#### (19) 世界知的所有権機関 国際事務局



# 

(43) 国際公開日 2003 年12 月18 日 (18.12.2003)

**PCT** 

## (10) 国際公開番号 WO 03/103665 A1

(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: A61K 31/427, 31/5375, 31/055, 31/137, 31/15, 31/167, 31/18, 31/357, 31/381, 31/403, 31/4035, 31/404, 31/421, 31/422, 31/445, 31/4453, 31/455, 31/47, 31/498, 31/606, 31/609, 31/616, 31/63, A61P 11/06, 17/00, 17/04, 37/08, 15/00, A61K 31/426, C07D 277/44

(21) 国際出願番号: PCT/JP03/07120

(22) 国際出願日: 2003 年6 月5 日 (05.06.2003)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ: 特願2002-165148 2002 年6 月6 日 (06.06.2002) JF

- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 株式会社 医薬分子設計研究所 (INSTITUTE OF MEDICINAL MOLECULAR DESIGN. INC.) [JP/JP]; 〒113-0033 東 京都文京区本郷5丁目24番5号 角川本郷ビル4 F Tokyo (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 武藤 進 (MUTO,Susumu) [JP/JP]; 〒184-0003 東京都 小金井市 緑町 1-6-7 メイプルコーポB202 Tokyo (JP). 板井 昭子 (ITAI,Akiko) [JP/JP]; 〒113-0033 東京都文

京区 本郷 5 丁目 2 4番 5 号 角川本郷ビル 4 F 株式 会社医薬分子設計研究所内 Tokyo (JP).

- (74) 代理人: 特許業務法人特許事務所サイクス (SIKS & CO.); 〒104-0031 東京都 中央区 京橋一丁目 8番7号京橋日殖ビル8階 Tokyo (JP).
- (81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

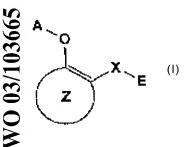
#### 添付公開書類:

#### — 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される 各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語 のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: ANTIALLERGIC

(54) 発明の名称: 抗アレルギー薬



(57) Abstract: A medicine for the prevention of and/or treatments for allergic diseases and/or endometriosis and/or uterus myoma, which contains as an active ingredient a substance selected from the group consisting of a compound represented by the general formula (I): (I) (wherein X represents a connecting group in which the main chain has 2 to 5 atoms; A represents hydrogen, etc.; E represents optionally substituted aryl; and ring Z represents, e.g., arene which may have one or more substituents besides the groups represented by the formulae -O-A and -X-E), a pharmacologically acceptable salt of the compound, hydrates of these, and solvates of these.

# (57) 要約:

一般式(I)(式中、Xは主鎖の原子数2-5である連結基を表し、Aは水素原子等を表し、Eは置換基を有してもよいアリール基を表し、環 Z は、式-O-A 及び式-X-Eで表される基の他に更に置換基を有してもよいアレーン等を表す)で表される化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含む、アレルギー性疾患及び/又は子宮内膜症及び/又は子宮筋腫の予防及び/又は治療のための医薬。

### 明細書

#### 抗アレルギー薬

#### 技術分野

本発明は花粉症、気管支喘息、アトピー性皮膚炎、蕁麻疹などのアレルギー性の疾患及び子宮内膜症、子宮筋腫の予防及び/又は治療に有効な医薬に関する。

#### 背景技術

アレルギー性疾患は、体内に侵入した抗原刺激により IgE が産生され、この抗原と IgE の複合体により刺激を受けた活性化マスト細胞から脱顆粒により種々の炎症性サイトカインやヒスタミン、ロイコトリエン等のケミカルメディエーターが放出され、これらにより気道の収縮や血管透過性の亢進、皮膚や気管支等の炎症を惹き起こすものであると理解されている。従って、抗アレルギー薬は I型アレルギー反応とそれに続発するアレルギー性炎症を抑える薬剤、ことにマスト細胞からのメディエーターの生成、遊離を抑制する薬剤、あるいはその作用に拮抗する薬剤を中心として理解されている。現在抗アレルギー薬としてはステロイド、抗ヒスタミン剤、メディエーター遊離抑制または阻害薬などが用いられている。ステロイドは非常に有効な薬剤ではあるが、副作用の問題があり、抗ヒスタミン剤は対症療法的なもので根本治療には結びつかず、メディエーター遊離抑制または阻害剤は有効性が高いとは言われているが、即効性に欠けていたり、中枢性の副作用を有するものもあり、これまでの抗アレルギー剤では必ずしも満足のいく情況ではないのが現状である。

子宮内膜症は近年増加傾向にあり、現在女性の10~14%が罹患しているといわれ、生理や性交時に激しい痛みを伴う等で患者の quality of life の低下を招くだけでなく、不妊の原因としても注目を集めている。現在その治療では偽閉経療法としてホルモン剤を使った治療が行われているが、副作用が強いばかりでな

く、長期の投与が骨粗鬆症を招く恐れがあることから、今のところ安全で有効性 の高い治療薬または治療方法がないのが現状である。

近年になって、子宮内膜症の病変部にマスト細胞が明らかに高密度で存在し(「アメリカン・ジャーナル・オブ・リプロダクティブ・イムノロジー(ニューヨーク:1989)(American Journal of Reproductive Immunology(New York:1998))」,(デンマーク),1998年,第40巻,第4号,p. 291-294)、そのマスト細胞が活性化し脱顆粒をおこしていることも見出された(「日経メディカル(Nikkei Medical)」,2002年,第415号,p. 28;「フェアティリティー・アンド・ステリリティー(Fertility and sterility)」,(米国),2002年,第78巻,第4号,p. 782-786)。更に、子宮内膜症モデルラットへの抗アレルギー作用を持つロイコトリエン拮抗薬の投与で、肥満細胞の浸潤および病変の主体をなす間質増生が有意に抑制されることから(「日経メディカル(Nikkei Medical)」,2002年,第415号,p. 28;「フェアティリティー・アンド・ステリリティー(Fertility and sterility)」,(米国),2002年,第78巻,第4号,p. 782-786)、子宮内膜症とアレルギーとの関連が強く示唆される。

従って、マスト細胞の活性化を強力に抑制し、アレルギー疾患の根本的な治療薬 となりうるような抗アレルギー薬は子宮内膜症の有効な治療薬となりうる。

子宮筋腫も子宮内膜症患者の45%が罹患していることから、子宮内膜症と同様にアレルギーとの関連を示唆することができる。よってアレルギー疾患の根本的な治療薬となりうるような抗アレルギー薬は子宮筋腫の治療薬として有用である可能性が高い。

一方、N-フェニルサリチルアミド誘導体は米国特許第4358443号明細書に植物成長阻害剤としての開示があり、医薬としては欧州特許第0221211号明細書、特開昭62-99329号公報、及び米国特許第6117859号明細書に抗炎症剤として開示されている。また、国際公開第99/65499号パンフレット、国際公開第02/49632号パンフレット、及び国際公開第02

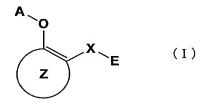
/076918号パンフレットにはNF-κB阻害剤として、国際公開第02/051397号パンフレットにはサイトカイン産生抑制剤として開示されている。

#### 発明の開示

本発明の課題は、アレルギー反応の抑制によるアレルギーの根本的予防及び/又は治療を可能にする医薬を提供することにある。本発明者らは上記の課題を解決すべく一般的に毒性の低いと言われているサリチルアミド誘導体の抗アレルギー作用について鋭意研究した結果、Nー置換サリチルアミド誘導体、とりわけN・アリールサリチルアミド誘導体、特にアニリン部分の2,5位又は3,5位が置換されたNーフェニルサリチルアミド誘導体、チアゾール環の4,5位が置換されたNーチアゾールー2一イルサリチルアミド誘導体が、活性化されたマスト細胞の増殖抑制作用、抗原とIgE刺激によるマスト細胞からの脱顆粒の抑制、及び活性化されたB細胞からのIgE産生抑制作用において極めて優れた活性を有しており、アレルギー疾患の根本的な予防及び/又は治療を達成できることを見出した。また、さらにその類縁体であるヒドロキシアリール誘導体についても検討を行い、本発明を完成するに至った。

すなわち、本発明は、

#### (1) 下記一般式(I):



(式中、

Xは、主鎖の原子数が2ないし5である連結基(該連結基は置換基を有していてもよい)を表し、

Aは、水素原子又はアセチル基を表し、

Eは、置換基を有していてもよいアリール基又は置換基を有していてもよいヘテ

ロアリール基を表し、

環Zは、式-O-A(式中、Aは上記定義と同義である)及び式-X-E(式中、X及びEは上記定義と同義である)で表される基の他に更に置換基を有していてもよいアレーン、又は式-O-A(式中、Aは上記定義と同義である)及び式-X-E(式中、X及びEは上記定義と同義である)で表される基の他に更に置換基を有していてもよいヘテロアレーンを表す)で表される化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含む、アレルギー性疾患及び/又は子宮内膜症及び/又は子宮筋腫の予防及び/又は治療のための医薬を提供するものである。本発明により提供される好適な医薬としては、

(2) Xが、下記連結基群  $\alpha$  より選択される基(該基は置換基を有していてもよい)である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含む上記の医薬、[連結基群  $\alpha$  ]下記式:

(式中、左側の結合手が環 Z に結合し右側の結合手が E に結合する)

# (3) Xが、下記式:



(式中、左側の結合手が環 Z に結合し右側の結合手が E に結合する)で表される基(該基は置換基を有していてもよい)である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含む上記の医薬、

- (4) Aが、水素原子である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含む上記の医薬、
- (5) 環Zが、 $C_6 \sim C_{10}$ のアレーン(該アレーンは、式-O-A(式中、Aは一般式(I)における定義と同義である)及び式-X-E(式中、X及びEは一般式(I)における定義と同義である)で表される基の他に更に置換基を有していてもよい)、又は5ないし13員のヘテロアレーン(該ヘテロアレーンは、式-O-A(式中、Aは一般式(I)における定義と同義である)及び式-X-E(式中、X及びEは一般式(I)における定義と同義である)で表される基の他に更に置換基を有していてもよい)である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含む上記の医薬医薬、

#### (6)環Zが、下記環群B:

[環群β] ベンゼン環、ナフタレン環、チオフェン環、ピリジン環、インドール環、キノキサリン環、及びカルバゾール環

より選択される環(該環は、式-O-A(式中、Aは一般式(I)における定義と同義である)及び式-X-E(式中、X及びEは一般式(I)における定義と同義である)で表される基の他に更に置換基を有していてもよい)である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含む上記の医薬、

(7) 環 Z が、式 - O - A (式中、A は一般式 (I) における定義と同義である) 及び式 - X - E (式中、X 及び E は一般式 (I) における定義と同義である) で表される基の他に更に置換基を有していてもよいベンゼン環である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含む上記の医薬、

- (8) 環 Z が、式 O A (式中、A は一般式 (I) における定義と同義である) 及び式 X E (式中、X 及び E は一般式 (I) における定義と同義である) で表される基の他にハロゲン原子を更に有するベンゼン環である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含む上記の医薬、
- (9) 環 Z が、式 O A (式中、A は一般式 (I) における定義と同義である) 及び式 X E (式中、X 及び E は一般式 (I) における定義と同義である) で表される基の他に置換基を更に有していてもよいナフタレン環である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含む上記の医薬、
- (10) Eが、置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{10}$ のアリール基、又は置換基を有していてもよい5ないし13員の $^{\circ}$ のテロアリール基である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含む上記の医薬、
- (11) Eが、置換基を有していてもよいフェニル基である化合物及び薬理学的 に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群か ら選ばれる物質を有効成分として含む上記の医薬、
- (12) Eが、3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基である化合物及 び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物か らなる群から選ばれる物質を有効成分として含む上記の医薬、
- (13) Eが、置換基を有していてもよい5員のヘテロアリール基である化合物 及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物

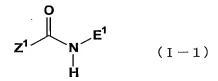
からなる群から選ばれる物質を有効成分として含む上記の医薬を挙げることがで きる。

別の観点からは、本発明により、上記の(1)~(13)の医薬の製造のための上記の各物質の使用が提供される。

また、本発明により、ヒトを含む哺乳類動物において、アレルギー性疾患及び/ 又は子宮内膜症及び/又は子宮筋腫を予防及び/又は治療する方法であって、上記 物質の予防及び/又は治療有効量をヒトを含む哺乳類動物に投与する工程を含む 方法が提供される。

さらに本発明により、

(1) 下記一般式(I-1):



(式中、 $Z^1$ は、5位に置換基を有していてもよい2-ヒドロキシフェニル基、 又は5位に置換基を有していてもよい2-アセトキシフェニル基を表し、  $E^1$ は、置換されていても良いフェニル基を表す)で表される化合物若しくはそ

の塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物が提供される。

好適には、

(2)  $E^1$ が、2, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基又は3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基を表す)で表される化合物若しくはその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物が提供される(ただし、下記の化合物を除く:

N-[3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] <math>-2-ヒドロキシベンズ アミド、

N-[3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]-5-クロロ-2-ヒドロキシベンズアミド、

N-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]-5-ブロモ-2-ヒド

ロキシベンズアミド、

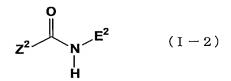
N-[3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]-2-ヒドロキシ-5-ョードベンズアミド、及び

N-[3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] <math>-2-ヒドロキシ-5- ニトロベンズアミド)。

さらに好適には、

(3)  $Z^1$ が、5位にハロゲン原子を有する2-ヒドロキシフェニル基、又は5位にハロゲン原子を有する2-アセトキシフェニル基である化合物若しくはその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物が提供される。また、本発明により、

# (1) 下記一般式(I-2):



(式中、Z<sup>2</sup>は、5位に置換基を有していてもよい2-ヒドロキシフェニル基、 又は5位に置換基を有していてもよい2-アセトキシフェニル基を表し、

 $E^2$ は、2,5-ジ置換フェニル基(該置換基のうち1個はトリフルオロメチル基である)、又は3,5-ジ置換フェニル基(該置換基のうち1個はトリフルオロメチル基である)を表す)で表される化合物若しくはその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物が提供される(ただし、下記の化合物を除く:

5-クロロ-N-[5-クロロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル]-2-ヒドロキシベンズアミド、

5-フルオロ-2-ヒドロキシ-N-[2-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ) <math>-5-(トリフルオロメチル) フェニル] ベンズアミド、

5-フルオロ-2-ヒドロキシ-N-[2-(6,6,6-トリフルオロヘキシ ルオキシ)-5-(トリフルオロメチル)フェニル]ベンズアミド、

5-クロロ-N-[2-(4-クロロフェノキシ)-5-(トリフルオロメチル)

フェニル] -2-ヒドロキシベンズアミド、

5-クロロ-2-ヒドロキシ-N-[2-(4-メチルフェノキシ)-5-(トリフルオロメチル)フェニル]ベンズアミド、

5-クロロ-N-[2-(4-クロロフェニル)スルファニル-5-(トリフルオロメチル)フェニル]-2-ヒドロキシベンズアミド、

5-クロロ-2-ヒドロキシ-N-[2-(1-ナフチルオキシ)-5-(トリフルオロメチル)フェニル]ベンズアミド、及び

 $5-\rho$ ロロー 2-ビドロキシ-N-[2-(2-ナフチルオキシ)-5-(トリフルオロメチル)フェニル]ベンズアミド)。

## 好適には、

(2) Z<sup>2</sup>が、5位にハロゲン原子を有する2-ヒドロキシフェニル基、又は5位にハロゲン原子を有する2-アセトキシフェニル基である化合物若しくはその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物が提供される。

また、本発明により、

(1) 下記一般式 (I-3):

$$Z^3$$
 $N$ 
 $E^3$ 
 $(I-3)$ 

(式中、 $Z^3$ は、5位に置換基を有していてもよい2-ヒドロキシフェニル基、 又は5位に置換基を有していてもよい2-アセトキシフェニル基を表し、  $E^3$ は、下記式:

(式中、R<sup>3 e 2</sup>及びR<sup>3 e 3</sup>は、一方が水素原子、他方が置換基を有していてもよい い炭化水素基又は置換基を有していてもよいヒドロキシ基を表し、

 $R^{3e5}$ は、置換基を有していてもよい $C_2 \sim C_6$ の炭化水素基を表す))で表される化合物若しくはその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物が提供される。

## 好適には、

(2) Z³が、5位にハロゲン原子を有する2-ヒドロキシフェニル基、又は5位にハロゲン原子を有する2-アセトキシフェニル基である請求項18に記載の化合物若しくはその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物が提供される。

また、本発明により、

(1) 下記一般式 (I-4):

$$Z^4$$
 $N$ 
 $E^4$ 
 $(I-4)$ 

(式中、 $Z^4$ は、5位に置換基を有していてもよい2-ヒドロキシフェニル基、 又は5位に置換基を有していてもよい2-アセトキシフェニル基を表し、  $E^4$ は、下記式:

(式中、R<sup>4 e 4</sup>は、置換基を有していてもよい炭化水素基を表し、

R<sup>4 e 5</sup>は、ハロゲン原子、シアノ基、置換基を有していてもよいアシル基、又は 置換基を有していてもよいヘテロ環基を表す))で表される化合物若しくはその塩、 又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物が提供される。

# 好適には、

(2) Z<sup>4</sup>が、5位にハロゲン原子を有する2-ヒドロキシフェニル基、又は5位にハロゲン原子を有する2-アセトキシフェニル基である化合物若しくはその 塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物が提供される。

#### 図面の簡単な説明

第1図は、本発明の医薬(化合物番号50)の即時型アレルギー反応抑制効果を 示した図である。

第2図は、本発明の医薬(化合物番号50)のアトピー性皮膚炎モデルによる皮膚炎抑制効果を示した図である。

#### 発明を実施するための最良の形態

本発明の理解のために「国際公開第02/49632号パンフレット」の開示を参照することは有用である。上記「国際公開第02/49632号パンフレット」の開示の全てを参照として本明細書の開示に含める。

本明細書において用いられる用語の意味は以下の通りである。

「ハロゲン原子」としては、特に言及する場合を除き、弗素原子、塩素原子、臭素原子、又は沃素原子のいずれを用いてもよい。

「炭化水素基」としては、例えば、脂肪族炭化水素基、アリール基、アリーレン 基、アラルキル基、架橋環式炭化水素基、スピロ環式炭化水素基、及びテルペン 系炭化水素等が挙げられる。

「脂肪族炭化水素基」としては、例えば、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アルキレン基、アルケニレン基、アルキリデン基等の直鎖状又は分枝鎖状の1価若しくは2価の非環式炭化水素基;シクロアルキル基、シクロアルケニル基、シクロアルカンジエニル基、シクロアルキルーアルキル基、シクロアルキレン基、シクロアルケニレン基等の飽和又は不飽和の1価若しくは2価の脂環式炭化水素基等が挙げられる。

「アルキル基」としては、例えば、メチル、エチル、nープロピル、イソプロピル、nーブチル、イソブチル、secーブチル、tertーブチル、nーペンチル、イソペンチル、2ーメチルブチル、1ーメチルブチル、ネオペンチル、1,2ージメチルプロピル、1ーエチルプロピル、nーヘキシル、4ーメチルペンチ

ル、3-メチルペンチル、2-メチルペンチル、1-メチルペンチル、3, 3-ジメチルブチル、2, 2-ジメチルブチル、1, 1-ジメチルブチル、1, 2-ジメチルブチル、1, 3-ジメチルブチル、2, 3-ジメチルブチル、2-エチルブチル、1-エチルブチル、1-エチルプロピル、1-エチルブチル、1-エチルブチル、1-エチルプロピル、1-エチルプロピル、1-エチル、1-エチル、1-エチル、1-エチルプロピル、1-ステンル、1-エチル、1-エチル、1-エチル、1-エチル、1-エチル、1-エチル、1-ステンタデシル等の1-2、1-3の直鎖状又は分枝鎖状のアルキル基が挙げられる。

「アルケニル基」としては、例えば、ビニル、プロパー1-エン-1-イル、ア リル、イソプロペニル、ブター1-エンー1-イル、ブター2-エンー1-イル、 ブター3-エン-1-イル、2-メチルプロパー2-エン-1-イル、1-メチ ルプロパー2-エン-1-イル、ペンター1-エン-1-イル、ペンター2-エ ン-1-イル、ペンタ-3-エン-1-イル、ペンタ-4-エン-1-イル、3 ーメチルブター2ーエンー1ーイル、3ーメチルブター3ーエンー1ーイル、へ キサー1-エンー1-イル、ヘキサー2-エンー1-イル、ヘキサー3-エンー 1-イル、ヘキサ-4-エン-1-イル、ヘキサ-5-エン-1-イル、4-メ チルペンター3-エン-1-イル、4-メチルペンター3-エン-1-イル、へ プター1-エンー1-イル、ヘプター6-エンー1-イル、オクター1-エンー 1-イル、オクター7-エン-1-イル、ノナ-1-エン-1-イル、ノナ-8 ーエンー1ーイル、デカー1ーエンー1ーイル、デカー9ーエンー1ーイル、ウ ンデカー1ーエンー1ーイル、ウンデカー10ーエンー1ーイル、ドデカー1ー エンー1ーイル、ドデカー11-エンー1ーイル、トリデカー1-エンー1ーイ ル、トリデカー12-エン-1-イル、テトラデカー1-エン-1-イル、テト ラデカー13-エンー1-イル、ペンタデカー1-エン-1-イル、ペンタデカ -14-エン-1-イル等の $C_2\sim C_{15}$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルケニル基が 挙げられる。

「アルキニル基」としては、例えば、エチニル、プロパー1-イン-1-イル, プロパー2-イン-1-イル,ブター1-イン-1-イル、ブター3-イン-1

ーイル、1-メチルプロパー2-インー1-イル、ペンター1-インー1-イル、ペンター4-インー1-イル、ヘキサー1-イル、ヘキサー1-イン、ヘキサー1-イン、ヘキサー1-イン、ヘナー1-イル、ヘナー1-イル、オクター1-インー1-イル、オクター1-インー1-イル、オクター1-インー1-イル、ブカー1-インー1-イル、ブカー1-イン・デージー1-イン・デージー

「アルキレン基」としては、例えば、メチレン、エチレン、エタン-1, 1-ジイル、プロパン-1, 3-ジイル、プロパン-1, 2-ジイル、プロパン-2, 2-ジイル、ブタン-1, 4-ジイル、ペンタン-1, 5-ジイル、ヘキサン-1, 6-ジイル、1, 1, 4, 4-テトラメチルブタン-1, 4-ジイル等の-10 -12 -12 -13 -14 -15

「アルケニレン基」としては、例えば、エテンー 1,2 ージイル、プロペンー 1,3 ージイル、ブター 1 ーエンー 1,4 ージイル、ブター 2 ーエンー 1,4 ージイル、 2 ーメチルプロペンー 1,3 ージイル、ペンター 2 ーエンー 1,5 ージイル、ヘキサー 3 ーエンー 1,6 ージイル等の  $C_1$  ~  $C_6$  の直鎖状又は分枝鎖状のアルキレン基が挙げられる。

「アルキリデン基」としては、例えば、メチリデン、エチリデン、プロピリデン、イソプロピリデン、ブチリデン、ペンチリデン、ヘキシリデン等の $C_1 \sim C_6$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルキリデン基が挙げられる。

「シクロアルキル基」としては、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル等の $C_3 \sim C_8$ のシクロアルキル基が挙げられる。

なお、上記「シクロアルキル基」は、ベンゼン環、ナフタレン環等と縮環していてもよく、例えば、1ーインダニル、2ーインダニル、1, 2, 3, 4ーテトラヒドロナフタレン-1ーイル、1, 2, 3, 4ーテトラヒドロナフタレン-2ーイル等の基が挙げられる。

「シクロアルケニル基」としては、例えば、2-シクロプロペン-1-イル、2-シクロブテン-1-イル、2-シクロペンテン-1-イル、3-シクロペンテン-1-イル、2-シクロヘキセン-1-イル、3-シクロヘキセン-1-イル、1-シクロブテン-1-イル、1-シクロペンテン-1-イル等の $C_3\sim C_6$ のシクロアルケニル基が挙げられる。

なお、上記「シクロアルケニル基」は、ベンゼン環、ナフタレン環等と縮環していてもよく、例えば、1ーインダニル、2ーインダニル、1, 2, 3, 4ーテトラヒドロナフタレン-1ーイル、1, 2, 3, 4ーテトラヒドロナフタレン-2ーイル、1ーインデニル、2ーインデニル等の基が挙げられる。

「シクロアルカンジエニル基」としては、例えば、2, 4 — シクロペンタンジエンー1 — イル、2, 4 — シクロヘキサンジエンー1 — イル、2, 5 — シクロヘキサンジエンー1 — イル等の $C_5$   $\sim$   $C_6$  のシクロアルカンジエニル基が挙げられる。なお、上記「シクロアルカンジエニル基」は、ベンゼン環、ナフタレン環等と縮環していてもよく、例えば、1 — インデニル、2 — インデニル等の基が挙げられる。

「シクロアルキルーアルキル基」としては、「アルキル基」の1つの水素原子が、「シクロアルキル基」で置換された基が挙げられ、例えば、シクロプロピルメチル、1-シクロプロピルエチル、2-シクロプロピルエチル、3-シクロプロピルルプロピル、4-シクロプロピルブチル、5-シクロプロピルペンチル、6-シクロプロピルへキシル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロへキシルプロピル、シクロペキシルブチル、シクロへキシルブチル、シクロへキシルブチル、シクロへキシルブチル、シクロスキシルブチル、シクロオクチルメチル、6-シクロオクチルへキシル等の $C_4$ ~ $C_{14}$ のシクロアルキルーアルキル基が挙

げられる。

「シクロアルキレン基」としては、例えば、シクロプロパン-1, 1-ジイル、シクロプロパン-1, 2-ジイル、シクロブタン-1, 1-ジイル、シクロブタン-1, 1-ジイル、シクロペンタン-1, 1-ジイル、シクロペンタン-1, 1-ジイル、シクロペンタン-1, 1-ジイル、シクロペンタン-1, 1-ジイル、シクロペンタン-1, 1-ジイル、シクロペキサン-1, 1-ジイル、シクロペキサン-1, 1-ジイル、シクロペキサン-1, 1-ジイル、シクロペナン-1, 1-ジイル、シクロペプタン-1, 1-ジイル、シクロペプタン-1, 1-ジイル、シクロペプタン-1, 1-ジイル、シクロオクタン-1, 1-ジイル等の-10 のシクロアルキレン基が挙げられる。

「アリール基」としては、単環式又は縮合多環式芳香族炭化水素基が挙げられ、例えば、フェニル、1-ナフチル、2-ナフチル、アントリル、フェナントリル、アセナフチレニル等の $C_6\sim C_{14}$ のアリール基が挙げられる。

ニル、9-フェナレニル等の基が挙げられる。

「アリーレン基」としては、例えば、1, 2-フェニレン、1, 3-フェニレン、1, 4-フェニレン、ナフタレン-1, 2-ジイル、ナフタレン-1, 3-ジイル、ナフタレン-1, 4-ジイル、ナフタレン-1, 5-ジイル、ナフタレン-1, 6-ジイル、ナフタレン-1, 7-ジイル、ナフタレン-1, 8-ジイル、ナフタレン-2, 3-ジイル、ナフタレン-2, 4-ジイル、ナフタレン-2, 5-ジイル、ナフタレン-2, 6-ジイル、ナフタレン-2, 7-ジイル、ナフタレン-2, 8-ジイル、アントラセン-1, 4-ジイル等の $C_6 \sim C_{14}$ のアリーレン基が挙げられる。

「アラルキル基」としては、「アルキル基」の1つの水素原子が、「アリール基」で置換された基が挙げられ、例えば、ベンジル、1-ナフチルメチル、2-ナフチレニルメチル、アントラセニルメチル、フェナントレニルメチル、アセナフチレニルメチル、ジフェニルメチル、1- (1-ナフチル) エチル、1- (1-ナフチル) アロピル、1- (1-ナフチル) アロピル、1- (1- (1- (1- (1- ) アラル・1- (1- ) アラル・1- (1- ) アラルキル基が挙げられる。

「架橋環式炭化水素基」としては、例えば、ビシクロ [2.1.0] ペンチル、ビシクロ [2.2.1] ヘプチル、ビシクロ [2.2.1] オクチル、アダマンチル等の基が挙げられる。

「スピロ環式炭化水素基」、としては、例えば、スピロ[3.4]オクチル、スピロ[4.5]デカー[4.5]デカー[4.5] デカー[4.5] デカー[4

「テルペン系炭化水素」としては、例えば、ゲラニル、ネリル、リナリル、フィチル、メンチル、ボルニル等の基が挙げられる。

「ハロゲン化アルキル基」としては、「アルキル基」の1つの水素原子が「ハロゲン原子」で置換された基が挙げられ、例えば、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、ブロモメチル、ジブロモメチル、トリブロモメチル、ヨードメチル、ジョードメチル、トリヨードメチル、2,2,2ートリフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、3,3,3ートリフルオロプロピル、ヘプタフルオロプロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、ノナフルオロブチル、パーフルオロヘキシル等の1乃至13個のハロゲン原子で置換された $C_1 \sim C_6$ の直鎖状又は分枝鎖状のハロゲン化アルキル基が挙げられる。

「ヘテロ環基」としては、例えば、環系を構成する原子(環原子)として、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子等から選択されたヘテロ原子1乃至3種を少なくとも1個含む単環式又は縮合多環式ヘテロアリール基、並びに、環系を構成する原子(環原子)として、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子等から選択されたヘテロ原子1乃至3種を少なくとも1個含む単環式又は縮合多環式非芳香族ヘテロ環基が挙げられる。

「単環式へテロアリール基」としては、例えば、2-フリル、3-フリル、2-チエニル、3-チエニル、1-ピロリル、2-ピロリル、3-ピロリル、2ーオ キサゾリル、4ーオキサゾリル、5ーオキサゾリル、3ーイソオキサゾリル、4 ーイソオキサゾリル、5ーイソオキサゾリル、2ーチアゾリル、4ーチアゾリル、 5ーチアゾリル、3ーイソチアゾリル、4ーイソチアゾリル、5ーイソチアゾリル、1ーイミダゾリル、2ーイミダゾリル、4ーイミダゾリル、5ーイミダゾリル、1ーピラゾリル、3ーピラゾリル、4ーピラゾリル、5ーピラゾリル、(1,2,3ーオキサジアゾール)ー5ーイル、(1,2,4ーオキサジアゾール)ー3ーイル、(1,2,4ーオキサジアゾール)ー5ーイル、(1,2,4ーオキサジアゾール)ー5ーイル、(1,3,4ーオキサジアゾール)ー2ーイル、(1,3,4ーオキサジアゾール)ー5ーイル、(1,3,4ーオキサジアゾール)ー5ーイル、フラザニル、(1,2,3ー

2, 4-チアジアゾール) <math>-3-イル、(1, 2, 4-チアジアゾール) -5-イ ル、(1, 2, 5-fアジアゾール)-3-fル、(1, 2, 5-fアジアゾール)アゾリル) -5-イル、(1H-1, 2, 3-トリアゾール) -1-イル、(1H-1, 2, 3-トリアゾール) -4-イル、(1H-1, 2, 3-トリアゾール)-5-イル、(2H-1, 2, 3-トリアゾール) -2-イル、(2H-1, 2,3-トリアゾール) -4-イル、(1H-1, 2, 4-トリアゾール) -1-イル、 (1H-1, 2, 4-トリアゾール) -3-イル、<math>(1H-1, 2, 4-トリアゾール) -5 - イル、(4H-1, 2, 4-トリアゾール) -3 - イル、(4H-1, 4H-1)2, 4-トリアゾール) -4-イル、 $(1\,H-$ テトラゾール) -1-イル、 $(1\,H$ ーテトラゾール) -5-イル、(2H-テトラゾール) -2-イル、(2H-テト ラゾール) -5-イル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、3ーピリ ダジニル、4ーピリダジニル、2ーピリミジニル、4ーピリミジニル、5ーピリ ミジニル、2-ピラジニル、(1, 2, 3-トリアジン)-4-イル、(1, 2, 3-3-トリアジン) -5-イル、(1, 2, 4-トリアジン) -3-イル、(1, 2, 4-4-トリアジン) -5-イル、(1, 2, 4-トリアジン) -6-イル、(1, 3, 4-5-トリアジン) -2-イル、1-アゼピニル、1-アゼピニル、2-アゼピニ 4-オキサゼピン) -3-イル、(1, 4-オキサゼピン) -5-イル、(1, 4)-オキサゼピン)-6-イル、(1, 4-オキサゼピン)-7-イル、(1, 4-ピン) -5- イル、(1, 4-チアゼピン) -6- イル、(1, 4-チアゼピン) - 7 - イル等の5乃至7員の単環式へテロアリール基が挙げられる。

「縮合多環式へテロアリール基」としては、例えば、2-ベンゾフラニル、3-ベンゾフラニル、4-ベンゾフラニル、5-ベンゾフラニル、6-ベンゾフラニル、7-ベンゾフラニル、1-イソベンゾフラニル、4-イソベンゾフラニル、

5-イソベンゾフラニル、2-ベンゾ [b] チエニル、3-ベンゾ [b] チエニ ル、4 - ベンゾ [b] チェニル、5 - ベンゾ [b] チェニル、6 - ベンゾ [b]チエニル、7 ーベンゾ [b] チエニル、1 ーベンゾ [c] チエニル、4 ーベンゾ [c]  $\mathcal{F}$   $\mathcal$ 2ーインドリル、3ーインドリル、4ーインドリル、5ーインドリル、6ーイン ドリル、7-インドリル、(2H-イソインドール) -1-イル、(2H-イソイ ンドール) -2 -イル、(2H-イソインドール) -4 -イル、(2H-イソイン-3-イル、(1H-インダゾール)-4-イル、(1H-インダゾール)-5-イル、(1H-インダゾール)-6-イル、<math>(1H-インダゾール)-7-イル、 - 1 (2H-1ンダゾール) - 1 (2H-1ンダゾール) - 1 (2 - ベンゾオ キサゾリル、2-ベンゾオキサゾリル、4-ベンゾオキサゾリル、5-ベンゾオ キサゾリル、6-ベンゾオキサゾリル、7-ベンゾオキサゾリル、(1,2-ベン ゾイソオキサゾール) -3-イル、(1,2-ベンゾイソオキサゾール) -4-イ ル、(1, 2-ベンゾイソオキサゾール) - 5 - イル、<math>(1, 2-ベンゾイソオキサゾール)-6-7ル、(1, 2-4)グイソオキサゾール)-7-7ル、(2, 4)1-ベンゾイソオキサゾール)-3-イル、(2,1-ベンゾイソオキサゾール) -4-1ル、(2, 1-1)ベンゾイソオキサゾール(2, 1-1)(2, 1 - (2, 1 - (2, 1 + (2, 1 + (2, 1 + (2, 1 + (2, 2) + (2, 2 + (2, 2) + (2, 2 + (2, 2) + (2, 2) + (2, 2) + (2, 2, 2) + (2, 2, 2) + (2, 2, 2) + (2, 2, 2)))2-ベンゾチアゾリル、4-ベンゾチアゾリル、5-ベンゾチアゾリル、6-ベ ンゾチアゾリル、7ーベンゾチアゾリル、(1,2ーベンゾイソチアゾール)-3 -イル、(1, 2-ベンゾイソチアゾール)-4-イル、(1, 2-ベンゾイソチ アゾール)-5-イル、(1, 2-ベンゾイソチアゾール)-6-イル、(1, 2)ーベンゾイソチアゾール)-7-イル、(2,1-ベンゾイソチアゾール)-3-イル、(2,1ーベンゾイソチアゾール)-4-イル、(2,1ーベンゾイソチア ゾール) -5 - イル、(2, 1 - ベンゾイソチアゾール) -6 - イル、(2, 1 -

ベンゾイソチアゾール) - 7 - イル、(1, 2, 3 - ベンゾオキサジアゾール) -4-イル、(1, 2, 3-ベンゾオキサジアゾール)-5-イル、(1, 2, 3-ベンゾオキサジアゾール) -6-イル、(1, 2, 3-ベンゾオキサジアゾール) -7-7ル、(2, 1, 3-4)がオキサジアゾール(2, 1, 3)ーベンゾオキサジアゾール) -5-イル、(1,2,3-ベンゾチアジアゾール) -4 - イル、(1, 2, 3 - ベンゾチアジアゾール) - 5 - イル、(1, 2, 3 -ベンゾチアジアゾール)-6-イル、(1,2,3-ベンゾチアジアゾール)-7 -イル、(2, 1, 3 - ベンゾチアジアゾール) <math>-4 -イル、(2, 1, 3 - ベンゾチアジアゾール)-5-イル、(1H-ベンゾトリアゾール)-1-イル、(1 H-ベンゾトリアゾール)-4-イル、(1H-ベンゾトリアゾール)-5-イル、 (1 H - ベンゾトリアゾール) - 6 - イル、<math>(1 H - ベンゾトリアゾール) - 7 -イル、(2H-ベンゾトリアゾール) -2-イル、(2H-ベンゾトリアゾール) -4-イル、(2H-ベンゾトリアゾール)-5-イル、2-キノリル、3-キノ リル、4ーキノリル、5ーキノリル、6ーキノリル、7ーキノリル、8ーキノリ ル、1-イソキノリル、3-イソキノリル、4-イソキノリル、5-イソキノリ ル、6-イソキノリル、7-イソキノリル、8-イソキノリル、3-シンノリニ ル、4-シンノリニル、5-シンノリニル、6-シンノリニル、7-シンノリニ ル、8-シンノリニル、2-キナゾリニル、4-キナゾリニル、5-キナゾリニ ル、6-キナゾリニル、7-キナゾリニル、8-キナゾリニル、2-キノキサリ ニル、5-キノキサリニル、6-キノキサリニル、1-フタラジニル、5-フタ ラジニル、6-フタラジニル、2-ナフチリジニル、3-ナフチリジニル、4-ナフチリジニル、2ープリニル、6ープリニル、7ープリニル、8ープリニル、 2-プテリジニル、4-プテリジニル、6-プテリジニル、7-プテリジニル、 1-カルバゾリル、2-カルバゾリル、3-カルバゾリル、4-カルバゾリル、  $9-カルバゾリル、<math>2-(\alpha-)$ カルボリニル)、 $3-(\alpha-)$ カルボリニル)、4- $(\alpha-\pi)$ ルボリニル)、 $5-(\alpha-\pi)$ ルボリニル)、 $6-(\alpha-\pi)$ ルボリニル)、7 $-(\alpha-\pi)$ カルボリニル)、 $8-(\alpha-\pi)$ ルボリニル)、 $9-(\alpha-\pi)$ ルボリニル)、

1-(β-π)ルボニリル)、3-(β-π)ルボニリル)、4-(β-π)ルボニリル)、  $5-(\beta-\pi)$ ルボニリル)、 $6-(\beta-\pi)$ ルボニリル)、 $7-(\beta-\pi)$ ルボニリル)、 8-(β-π)ルボニリル)、9-(β-π)ルボニリル)、1-(γ-π)ルボリニル)、  $2 - (y - \pi)$ ルボリニル)、 $4 - (y - \pi)$ ルボリニル)、 $5 - (y - \pi)$ ルボリニル)、 6 - (y - カルボリニル), 7 - (y - カルボリニル), 8 - (y - カルボリニル),9-(ヮーカルボリニル)、1-アクリジニル、2-アクリジニル、3-アクリジ ニル、4-アクリジニル、9-アクリジニル、1-フェノキサジニル、2-フェ ノキサジニル、3-フェノキサジニル、4-フェノキサジニル、10-フェノキ サジニル、1-フェノチアジニル、2-フェノチアジニル、3-フェノチアジニ ル、4-フェノチアジニル、10-フェノチアジニル、1-フェナジニル、2-フェナジニル、1-フェナントリジニル、2-フェナントリジニル、3-フェナ ントリジニル、4-フェナントリジニル、6-フェナントリジニル、7-フェナ ントリジニル、8-フェナントリジニル、9-フェナントリジニル、10-フェ ナントリジニル、2-フェナントロリニル、3-フェナントロリニル、4-フェ ナントロリニル、5-フェナントロリニル、6-フェナントロリニル、7-フェ ナントロリニル、8-フェナントロリニル、9-フェナントロリニル、10-フ ェナントロリニル、1ーチアントレニル、2ーチアントレニル、1ーインドリジ ニル、2-インドリジニル、3-インドリジニル、5-インドリジニル、6-イ ンドリジニル、7-インドリジニル、8-インドリジニル、1-フェノキサチイ ニル、2-フェノキサチイニル、3-フェノキサチイニル、4-フェノキサチイ ニル、チエノ〔2,3-b〕フリル、ピロロ〔1,2-b〕ピリダジニル、ピラ ゾロ[1, 5-a]ピリジル、イミダゾ[11, 2-a]ピリジル、イミダブ[1, 2-a]5-a] ピリジル、イミダゾ〔1, 2-b] ピリダジニル、イミダゾ〔1, 2-ba] ピリミジニル、1, 2, 4-トリアゾロ[4, 3-a] ピリジル、1, 2,4-トリアゾロ〔4,3-a〕ピリダジニル等の8乃至14員の縮合多環式ヘテ ロアリール基が挙げられる。

「単環式非芳香族へテロ環基」としては、例えば、1-アジリジニル、1-アゼチ

ジニル、1ーピロリジニル、2ーピロリジニル、3ーピロリジニル、2ーテトラヒドロフリル、3ーテトラヒドロフリル、チオラニル、1ーイミダゾリジニル、2ーイミダゾリジニル、4ーイミダゾリジニル、1ーピラゾリジニル、3ーピラゾリジニル、4ーピラゾリジニル、1ー(2ーピロリニル)、1ー(2ーイミダゾリニル)、2ー(2ーイミダゾリニル)、1ー(2ーピラゾリニル)、3ー(2ーピラゾリニル)、3ー(2ーピラゾリニル)、ピペリジノ、2ーピペリジニル、3ーピペリジニル、4ーピペリジニル、1ーホモピペリジニル、2ーテトラヒドロピラニル、モルホリノ、(チオモルホリン)ー4ーイル、1ーピペラジニル、1ーホモピペラジニル等の3万至7員の飽和若しくは不飽和の単環式非芳香族へテロ環基が挙げられる。

「縮合多環式非芳香族へテロ環基」としては、例えば、2ーキヌクリジニル、2 ークロマニル、3ークロマニル、4ークロマニル、5ークロマニル、6ークロマ ニル、7-クロマニル、8-クロマニル、1-イソクロマニル、3-イソクロマ ニル、4-イソクロマニル、5-イソクロマニル、6-イソクロマニル、7-イ ソクロマニル、8-イソクロマニル、2-チオクロマニル、3-チオクロマニル、 4-チオクロマニル、5-チオクロマニル、6-チオクロマニル、7-チオクロ マニル、8-チオクロマニル、1-イソチオクロマニル、3-イソチオクロマニ ル、4-イソチオクロマニル、5-イソチオクロマニル、6-イソチオクロマニ ル、7-イソチオクロマニル、8-イソチオクロマニル、1-インドリニル、2 ーインドリニル、3ーインドリニル、4ーインドリニル、5ーインドリニル、6 ーインドリニル、7ーインドリニル、1ーイソインドリニル、2ーイソインドリ ニル、4-イソインドリニル、5-イソインドリニル、2-(4H-クロメニル)、 3-(4H-クロメニル)、4-(4H-クロメニル)、5-(4H-クロメニル)、 6-(4H-クロメニル)、7-(4H-クロメニル)、8-(4H-クロメニル)、 1-イソクロメニル、3-イソクロメニル、4-イソクロメニル、5-イソクロ メニル、6-イソクロメニル、7-イソクロメニル、8-イソクロメニル、1-(1H-ピロリジニル)、2-(1H-ピロリジニル)、3-(1H-ピロリジニ ル)、5-(1H-ピロリジニル)、6-(1H-ピロリジニル)、7-(1H-ピ

ロリジニル)等の8万至10員の飽和若しくは不飽和の縮合多環式非芳香族へテロ環基が挙げられる。

上記「ヘテロ環基」の中で、環系を構成する原子(環原子)として、結合手を有する窒素原子の他に、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子等から選択されたヘテロ原子1乃至3種を有していてもよい単環式又は縮合多環式ヘテロアリール基、並びに、環系を構成する原子(環原子)として、結合手を有する窒素原子の他に、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子等から選択されたヘテロ原子1乃至3種を有していてもよい単環式又は縮合多環式非芳香族ヘテロ環基を「環状アミノ基」と称し、例えば、1ーピロリジニル、1ーイミダゾリジニル、1ーピラゾリジニル、1ーピープリジニル、1ーオキサゾリジニル、1ーチアゾリジニル、ピペリジノ、モルホリノ、1ーピペラジニル、チオモルホリンー4ーイル、1ーホモピペリジニル、1ーホモピペラジニル、クラジニル、2ーピロリンー1ーイル、2ーイミダゾリンー1ーイル、2ーピラゾリンー1ーイル、1ーインドリニル、2ーイソインドリニル、1, 2, 3, 4ーテトラヒドロキノリンー1ーイル、1, 2, 3, 4ーテトラヒドロキノリンー1ーイル、1ーイミダゾリル、1ーピラゾリル、1ーインドリル、1ーインダゾリル、2ーイソインドリル等の基が挙げられる。

上記「シクロアルキル基」、「シクロアルケニル基」、「シクロアルカンジエニル基」、「アリール基」、「シクロアルキレン基」、「シクロアルケニレン基」、「アリーレン基」、「架橋環式炭化水素基」、「スピロ環式炭化水素基」、及び「ヘテロ環基」を総称して「環式基」と称する。また、該「環式基」の中で、特に「アリール基」、「アリーレン基」、「単環式ヘテロアリール基」、及び「縮合多環式ヘテロアリール基」を総称して「芳香環式基」と称する。

「炭化水素-オキシ基」としては、「ヒドロキシ基」の水素原子が「炭化水素基」で置換された基が挙げられ、「炭化水素」としては、上記「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。「炭化水素-オキシ基」としては、例えば、アルコキシ基(アルキル-オキシ基)、アルケニル-オキシ基、アルキニル-オキシ基、シクロアルキル-オキシ基、シクロアルキル-オキシ基、シクロアルキル-オキシ基、シクロアルキル-オキシ基、シクロアルキル-オキシ

シ基;アリールーオキシ基;アラルキルーオキシ基;アルキレンージオキシ基等 が挙げられる。

「アルケニルーオキシ基」としては、例えば、ビニルオキシ、(プロパー1ーエンー1ーイル)オキシ、アリルオキシ、イソプロペニルオキシ、(ブター1ーエンー1ーイル)オキシ、(ブター2ーエンー1ーイル)オキシ、(ブター3ーエンー1ーイル)オキシ、(2ーメチルプロパー2ーエンー1ーイル)オキシ、(1ーメチルプロパー2ーエンー1ーイル)オキシ、(パンター1ーエンー1ーイル)オキシ、(ペンター2ーエンー1ーイル)オキシ、(ペンター3ーエンー1ーイル)オキシ、(ペンター4ーエンー1ーイル)オキシ、(3ーメチルブター3ーエンー1ーイル)オキシ、(ヘキサー1ーエンー1ーイル)オキシ、(ヘキサー2ーエンー1ーイル)オキシ、(ヘキサー3ーエンー1ーイル)オキシ、(ヘキサー4ーエンー1ーイル)オキシ、(ヘキサー5ーエンー1ーイル)オキシ、(ヘキサー4ーエンー1ーイル)オキシ、(ヘキサー5ーエンー1ーイル)オキシ、(4ーメチルペンター3ーエンー1ーイル)オキシ、(4

オキシ、(ヘプター6-エン-1-イル) オキシ、(オクター1-エン-1-イル) オキシ、(オクター7-エン-1-イル) オキシ、(ノナー8-エン-1-イル) オキシ、(デカー1-エン-1-イル) オキシ、(デカー1-エン-1-イル) オキシ、(デカー9-エン-1-イル) オキシ、(ウンデカー1-エン-1-イル) オキシ、(ウンデカー10-エン-1-イル) オキシ、(ドデカー10-エン-1-イル) オキシ、(ドデカー11-エン-1-イル) オキシ、(トリデカー11-エン-1-イル) オキシ、(トリデカー12-エン-1-イル) オキシ、(テトラデカー13-エン-1-イル) オキシ、(ペンタデカー1-エン-1-イル) オキシ、(ペンタデカー14-エン-1-イル) オキシ、(ペンタデカー14-エン-1-イル) オキシ、(ペンタデカー14-エン-1-イル) オキシ、(ペンタデカー14-エン-1-イル) オキシ等の12-エン-11-イル) オキシ、(ペンタデカー14-エン-11-イル) オキシ等の13-エン-14-エン-14-エン-14-エン-15-エンー15-エン-15-アルクニルーオキシ基が挙げられる。

「アルキニルーオキシ基」としては、例えば、エチニルオキシ、(プロパー1-イ ン-1-イル) オキシ, (プロパー2-イン-1-イル) オキシ, (ブター1-イ ン-1-イル)オキシ、(ブタ-3-イン-1-イル)オキシ、(1-メチルプロ  $\mathcal{N}-2-1$  (ペンター1ーインー1ーイル) オキシ、(ペンター1ーインー1ーイル) オキシ、(ペ ンター4ーイン-1ーイル) オキシ、(ヘキサー1ーイン-1ーイル) オキシ、(ヘ キサー5-イン-1-イル)オキシ、(ヘプタ-1-イン-1-イル)オキシ、(ヘ プター6ーインー1ーイル) オキシ、(オクター1ーインー1ーイル) オキシ、(オ クター7ーイン-1ーイル)オキシ、(ノナ-1ーイン-1ーイル)オキシ、(ノ ナー8ーイン-1ーイル)オキシ、(デカー1ーイン-1ーイル)オキシ、(デカ -9-イン-1-イル)オキシ、(ウンデカ-1-イン-1-イル)オキシ、(ウ ンデカー10-イン-1-イル)オキシ、(ドデカー1-イン-1-イル)オキシ、 (ドデカー11ーインー1ーイル)オキシ、(トリデカー1ーインー1ーイル)オ キシ、(トリデカー12-インー1-イル)オキシ、(テトラデカー1-イン-1 ーイル)オキシ、(テトラデカー13-イン-1-イル)オキシ、(ペンタデカー 1-イン-1-イル) オキシ、(ペンタデカ-14-イン-1-イル) オキシ等の C<sub>2</sub>~C<sub>15</sub>の直鎖状又は分枝鎖状のアルキニルーオキシ基が挙げられる。

「シクロアルキルーオキシ基」としては、例えば、シクロプロポキシ、シクロブトキシ、シクロペンチルオキシ、シクロヘキシルオキシ、シクロペプチルオキシ、シクロオクチルオキシ等の $C_3\sim C_8$ のシクロアルキルーオキシ基が挙げられる。「シクロアルキルーアルキルーオキシ基」としては、例えば、シクロプロピルメトキシ、1-シクロプロピルエトキシ、2-シクロプロピルエトキシ、3-シクロプロピルプロポキシ、4-シクロプロピルベキシルオキシ、シクロブチルメトキシ、シクロプロピルストキシ、シクロブチルメトキシ、シクロブチルメトキシ、シクロペンチルメトキシ、シクロベナルメトキシ、シクロペナシルメトキシ、シクロペキシルアロポキシ、4-シクロヘキシルブトキシ、シクロペプチルメトキシ、シクロペナシルブトキシ、シクロペナシルブトキシ、カロスキシルブロポキシ、4-シクロヘキシルブトキシ、シクロペプチルメトキシ、シクロオクチルメトキシ、カロオクチルペキシルオキシ等の $C_4\sim C_{14}$ のシクロアルキルーアルキルーオキシ基が挙げられる。

「アリールーオキシ基」としては、例えば、フェノキシ、1ーナフチルオキシ、2ーナフチルオキシ、アントリルオキシ、フェナントリルオキシ、アセナフチレニルオキシ等の $C_6 \sim C_{14}$ のアリールーオキシ基が挙げられる。

「アルキレンジオキシ基」としては、例えば、メチレンジオキシ、エチレンジオ

キシ、1-メチルメチレンジオキシ、1, 1-ジメチルメチレンジオキシ等の基 が挙げられる。

「ハロゲン化アルコキシ基(ハロゲン化アルキルーオキシ基)」としては、「ヒドロキシ基」の水素原子が「ハロゲン化アルキル基」で置換された基が挙げられ、例えば、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロメトキシ、ブロモメトキシ、ヨードメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、2,2,2ートリフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、3,3,3ートリフルオロプポキシ、ヘプタフルオロプポキシ、ノナフルオロブトキシ、パーフルオロヘキシルオキシ等の1乃至13個のハロゲン原子で置換された $C_1 \sim C_6$ の直鎖状又は分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ基が挙げられる。

「ヘテロ環ーオキシ基」としては、「ヒドロキシ基」の水素原子が、「ヘテロ環基」で置換された基が挙げられ、「ヘテロ環」としては、上記「ヘテロ環基」と同様の基が挙げられる。「ヘテロ環ーオキシ基」としては、例えば、単環式ヘテロアリールーオキシ基、縮合多環式ヘテロアリールーオキシ基、単環式非芳香族ヘテロ環ーオキシ基、縮合多環式非芳香族ヘテロ環ーオキシ基等が挙げられる。

「単環式へテロアリールーオキシ基」としては、例えば、3ーチエニルオキシ、 (イソキサゾールー3ーイル)オキシ、(チアゾールー4ーイル)オキシ、2ーピ リジルオキシ、3ーピリジルオキシ、(ピリミジンー4ーイ ル)オキシ等の基が挙げられる。

「縮合多環式へテロアリールーオキシ基」としては、5 - インドリルオキシ、(ベンズイミダゾール-2-イル) オキシ、2-キノリルオキシ、3-キノリルオキシ、3-キノリルオキシ、4-キノリルオキシ等の基が挙げられる。

「単環式非芳香族へテロ環ーオキシ基」としては、例えば、3 ーピロリジニルオキシ、4 ーピペリジニルオキシ等の基が挙げられる。

「縮合多環式非芳香族へテロ環ーオキシ基」としては、例えば、3ーインドリニルオキシ、4ークロマニルオキシ等の基が挙げられる。

「炭化水素ースルファニル基」としては、「スルファニル基」の水素原子が、「炭化水素基」で置換された基が挙げられ、「炭化水素」としては、上記「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。「炭化水素ースルファニル基」としては、例えば、アルキルースルファニル基、アルキニルースルファニル基、アルキニルースルファニル基、シクロアルキルースルファニル基、シクロアルキルースルファニル基等の脂肪族炭化水素ースルファニル基;アリールースルファニル基、アラルキルースルファニル基等が挙げられる。

「アルキルースルファニル基」としては、例えば、メチルスルファニル、エチル スルファニル、nープロピルスルファニル、イソプロピルスルファニル、nーブ チルスルファニル、イソブチルスルファニル、sec-ブチルスルファニル、t ertーブチルスルファニル、nーペンチルスルファニル、イソペンチルスルフ ァニル、(2-メチルブチル)スルファニル、(1-メチルブチル)スルファニル、 ネオペンチルスルファニル、(1, 2-ジメチルプロピル)スルファニル、(1-エチルプロピル) スルファニル、n - ヘキシルスルファニル、(4 - メチルペンチ ル)スルファニル、(3-メチルペンチル)スルファニル、(2-メチルペンチル) スルファニル、(1-メチルペンチル)スルファニル、(3,3-ジメチルブチル) スルファニル、(2, 2-ジメチルブチル)スルファニル、(1, 1-ジメチルブ チル)スルファニル、(1,2-ジメチルブチル)スルファニル、(1,3-ジメ チルブチル)スルファニル、(2,3-ジメチルブチル)スルファニル、(2-エ チルブチル)スルファニル、(1-エチルブチル)スルファニル、(1-エチル-1-メチルプロピル)スルファニル、n-ヘプチルスルファニル、n-オクチル スルファニル、n-ノニルスルファニル、n-デシルスルファニル、n-ウンデ シルスルファニル、n-ドデシルスルファニル、n-トリデシルスルファニル、 n-テトラデシルスルファニル、n-ペンタデシルスルファニル等の $C_1 \sim C_{15}$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルキルースルファニル基が挙げられる。

「アルケニルースルファニル基」としては、例えば、ビニルスルファニル、(プロパー1-エン-1-イル) スルファニル、アリルスルファニル、イソプロペニル

スルファニル、(ブター1ーエンー1ーイル) スルファニル、(ブター2ーエンー 1-イル)スルファニル、(ブター3-エンー1-イル)スルファニル、(2-メ チルプロパー2-エン-1-イル) スルファニル、(1-メチルプロパー2-エン ー1ーイル)スルファニル、(ペンター1ーエンー1ーイル)スルファニル、(ペ ンター2-エンー1-イル) スルファニル、(ペンター3-エンー1-イル) スル ファニル、(ペンター4ーエンー1ーイル) スルファニル、(3ーメチルブター2 ーエンー1ーイル)スルファニル、(3-メチルブター3-エンー1-イル)スル ファニル、(ヘキサー1ーエンー1ーイル) スルファニル、(ヘキサー2ーエンー 1ーイル)スルファニル、(ヘキサー3ーエンー1ーイル)スルファニル、(ヘキ サー4-エン-1-イル) スルファニル、(ヘキサー5-エン-1-イル) スルフ アニル、(4-メチルペンタ-3-エン-1-イル)スルファニル、(4-メチル ペンター3ーエンー1ーイル) スルファニル、(ヘプター1ーエンー1ーイル) ス ルファニル、(ヘプター6-エンー1-イル)スルファニル、(オクター1-エン ー1ーイル)スルファニル、(オクター7ーエンー1ーイル)スルファニル、(ノ ナー1ーエンー1ーイル) スルファニル、(ノナー8ーエンー1ーイル) スルファ ニル、(デカー1ーエンー1ーイル) スルファニル、(デカー9ーエンー1ーイル) スルファニル、(ウンデカー1ーエンー1ーイル)スルファニル、(ウンデカー1 0-エン-1-イル) スルファニル、(ドデカ-1-エン-1-イル) スルファニ ル、(ドデカー11-エンー1ーイル)スルファニル、(トリデカー1-エンー1 ーイル)スルファニル、(トリデカー12-エンー1-イル)スルファニル、(テ トラデカー1ーエンー1ーイル) スルファニル、(テトラデカー13ーエンー1ー イル)スルファニル、(ペンタデカー1-エンー1-イル)スルファニル、(ペン タデカー14-エンー1-イル)スルファニル等のC2~C15の直鎖状又は分枝 鎖状のアルケニルースルファニル基が挙げられる。

「アルキニルースルファニル基」としては、例えば、エチニルスルファニル、(プロパー1ーインー1ーイル) スルファニル,(プロパー2ーインー1ーイル) スルファニル,(ブター3ーインー1ーイル) スルファニル、(ブター3ーインー1ー

イル)スルファニル、(1-メチルプロパー2-イン-1-イル)スルファニル、 (ペンタ-1-イン-1-イル) スルファニル、(ペンタ-4-イン-1-イル)スルファニル、(ヘキサー1ーインー1ーイル)スルファニル、(ヘキサー5ーイ ンー1ーイル)スルファニル、(ヘプター1ーインー1ーイル、(ヘプター6ーイ ンー1ーイル) スルファニル、(オクター1ーインー1ーイル) スルファニル、(オ クター7ーインー1ーイル) スルファニル、(ノナー1ーインー1ーイル) スルフ ァニル、(ノナー8-イン-1-イル) スルファニル、(デカー1-イン-1-イ ル)スルファニル、(デカー9ーイン-1ーイル)スルファニル、(ウンデカー1 ーイン-1-イル)スルファニル、(ウンデカ-10-イン-1-イル)スルファ ニル、(ドデカー1ーイン-1ーイル)スルファニル、(ドデカー11ーイン-1 ーイル)スルファニル、(トリデカー1ーインー1ーイル)スルファニル、(トリ デカー12-イン-1-イル) スルファニル、(テトラデカー1-イン-1-イル) スルファニル、(テトラデカー13-イン-1-イル)スルファニル、(ペンタデ カー1ーインー1ーイル)スルファニル、(ペンタデカー14ーインー1ーイル) スルファニル等のC2~C15の直鎖状又は分枝鎖状のアルキニルースルファニル 基が挙げられる。

「シクロアルキルースルファニル基」としては、例えば、シクロプロピルスルファニル、シクロブチルスルファニル、シクロペンチルスルファニル、シクロへキシルスルファニル、シクロへプチルスルファニル、シクロオクチルスルファニル等の $C_3 \sim C_8$ のシクロアルキルースルファニル基が挙げられる。

「シクロアルキルーアルキルースルファニル基」としては、例えば、(シクロプロピルメチル) スルファニル、(1ーシクロプロピルエチル) スルファニル、(2ーシクロプロピルエチル) スルファニル、(3ーシクロプロピルプロピル) スルファニル、(4ーシクロプロピルブチル) スルファニル、(5ーシクロプロピルペンチル) スルファニル、(6ーシクロプロピルへキシル) スルファニル、(シクロブチルメチル) スルファニル、(シクロブチルメチル) スルファニル、(シクロブチルメチル) スルファニル、(シクロベンチルメチル) スルファニル、(シクロベンチルメチル) スルファニル、(シクロベ

シルメチル)スルファニル、 $(2-シクロへキシルエチル)スルファニル、<math>(3-\upsilon)$ クロへキシルプロピル)スルファニル、 $(4-\upsilon)$ クロへキシルブチル)スルファニル、 $(\upsilon)$ クロへプチルメチル)スルファニル、 $(\upsilon)$ クロオクチルメチル)スルファニル、 $(6-\upsilon)$ クロオクチルへキシル)スルファニル等の $C_4 \sim C_{14}$ のシクロアルキルーアルキルースルファニル基が挙げられる。

「アリールースルファニル基」としては、例えば、フェニルスルファニル、1-ナフチルスルファニル、2-ナフチルスルファニル、アントリルスルファニル、フェナントリルスルファニル、アセナフチレニルスルファニル等の $C_6 \sim C_{14}$ のアリールースルファニル基が挙げられる。

「アラルキルースルファニル基」としては、例えば、ベンジルスルファニル、(1ーナフチルメチル)スルファニル、(2ーナフチルメチル)スルファニル、(アントラセニルメチル)スルファニル、(フェナントレニルメチル)スルファニル、(アセナフチレニルメチル)スルファニル、(アセナフチレニルメチル)スルファニル、(グフェニルメチル)スルファニル、(1ーフェネチル)スルファニル、(1ーフェネチル)スルファニル、(1ー(1ーナフチル)エチル)スルファニル、(1ー(2ーナフチル)エチル)スルファニル、(2ー(1ーナフチル)エチル)スルファニル、(2ー(1ーナフチル)エチル)スルファニル、(3ーフェニルプロピル)スルファニル、(3ー(1ーナフチル)プロピル)スルファニル、(4ーフェニルブチル)スルファニル、(4ー(1ーナフチル)ブチル)スルファニル、(4ー(2ーナフチル)ブチル)スルファニル、(5ー(1ーナフチル)スルファニル、(6ー(1ーナフチル)スルファニル、(6ー(1ーナフチル)スルファニル、(6ー(1ーナフチル)スルファニル、(6ー(1ーナフチル)スキシル)スルファニル、(6ー(2ーナフチル)へキシル)スルファニル、(1ーナフチル)へキシル)スルファニル、(6ー(2ーナフチル)へキシル)スルファニル、(1ーナフチル)へキシル)スルファニル、(1ーナフチル)へキシル)スルファニル、(1ーナフチル)へキシル)スルファニル、(1ーナフチル)へキシル)スルファニル、(1ーナフチル)へキシル)スルファニル、(1ースルファニル来が挙げられる。

「ハロゲン化アルキルースルファニル基」としては、「スルファニル基」の水素原子が「ハロゲン化アルキル基」で置換された基が挙げられ、例えば、(フルオロメチル) スルファニル、(ブロモメチル) スルファ

ニル、(ヨードメチル) スルファニル、(ジフルオロメチル) スルファニル、(トリフルオロメチル) スルファニル、(トリクロロメチル) スルファニル、(2, 2, 2ートリフルオロエチル) スルファニル、(ペンタフルオロエチル) スルファニル、(3, 3, 3ートリフルオロプロピル) スルファニル、(ヘプタフルオロプロピル) スルファニル、(ヘプタフルオロイソプロピル) スルファニル、(ノナフルオロブチル) スルファニル、(パーフルオロベキシル) スルファニル等の1万至13個のハロゲン原子で置換された $C_1 \sim C_6$ の直鎖状又は分枝鎖状のハロゲン化アルキルースルファニル基が挙げられる。

「ヘテロ環ースルファニル基」としては、「スルファニル基」の水素原子が、「ヘテロ環基」で置換された基が挙げられ、「ヘテロ環」としては、上記「ヘテロ環基」と同様の基が挙げられる。「ヘテロ環ースルファニル基」としては、例えば、単環式ヘテロアリールースルファニル基、縮合多環式ヘテロアリールースルファニル基、単環式非芳香族ヘテロ環ースルファニル基、縮合多環式非芳香族ヘテロ環ースルファニル基等が挙げられる。

「単環式へテロアリールースルファニル基」としては、例えば、(イミダゾールー2ーイル) スルファニル、(1,2,4ートリアゾールー2ーイル) スルファニル、(ピリジンー2ーイル) スルファニル、(ピリジンー4ーイル) スルファニル、(ピリジンー2ーイル) スルファニル、(ピリジンー2ーイル) スルファニル等の基が挙げられる。

「縮合多環式へテロアリールースルファニル基」としては、(ベンズイミダゾール -2-イル)スルファニル、(キノリン-2-イル)スルファニル、(キノリン-4-イル)スルファニル等の基が挙げられる。

「単環式非芳香族へテロ環ースルファニル基」としては、例えば、(3-ピロリジニル)スルファニル、(4-ピペリジニル)スルファニル等の基が挙げられる。

「縮合多環式非芳香族へテロ環ースルファニル基」としては、例えば、(3ーインドリニル)スルファニル、(4ークロマニル)スルファニル等の基が挙げられる。「アシル基」としては、例えば、ホルミル基、グリオキシロイル基、チオホルミル基、カルバモイル基、チオカルバモイル基、スルファモイル基、スルフィナモ

イル基、カルボキシ基、スルホ基、ホスホノ基、及び下記式:

(式中、R \* 1 及びR b 1 は、同一又は異なって、炭化水素基又はヘテロ環基を表すか、あるいはR \* 1 及びR b 1 が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基を表す)で表される基が挙げられる。

上記「アシル基」の定義において、

式 ( $\omega$ -1A) で表される基の中で、R  $^{a1}$ が炭化水素基である基を「炭化水素 - カルボニル基」(具体例:アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、バレリル、イソバレリル、ピバロイル、ラウロイル、ミリストイル、パルミトイル、アクリロイル、プロピオロイル、メタクリロイル、クロトノイル、イソクロトノイル、シクロヘキシルカルボニル、シクロヘキシルメチルカルボニル、ベンゾイル、1ーナフトイル、2ーナフトイル、フェニルアセチル等の基)、R  $^{a1}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーカルボニル基」(具体例:2ーテノイル、3ーフロイル、ニコチノイル、イソニコチノイル等の基)と称する。

式( $\omega$  - 2 A)で表される基の中で、 $R^{a1}$ が炭化水素基である基を「炭化水素 - オキシーカルボニル基」(具体例:メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、フェノキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル等の基)、 $R^{a1}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーカルボニル基」(具体例:3- ピリジルオキシカルボニル等の基)と称する。

式(ω-3A)で表される基の中で、R<sup>al</sup>が炭化水素基である基を「炭化水素-カルボニルーカルボニル基」(具体例:ピルボイル等の基)、R<sup>al</sup>がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーカルボニルーカルボニル基」と称する。

式  $(\omega - 4A)$  で表される基の中で、 $R^{a1}$  が炭化水素基である基を「炭化水素 – オキシーカルボニルーカルボニル基」(具体例: メトキサリル、エトキサリル等の基)、 $R^{a1}$  がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーカルボニルーカルボニル基」と称する。

式( $\omega$  – 5 A)で表される基の中で、R  $^{a1}$ が炭化水素基である基を「炭化水素 – スルファニルーカルボニル基」、R  $^{a1}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環 – スルファニルーカルボニル基」と称する。

式( $\omega$  - 6 A)で表される基の中で、 $R^{a1}$ が炭化水素基である基を「炭化水素 - チオカルボニル基」、 $R^{a1}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環 - チオカルボニル基」と称する。

式 (ω-7A) で表される基の中で、R<sup>a1</sup>が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシーチオカルボニル基」、R<sup>a1</sup>がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシーチオカルボニル基」と称する。

式( $\omega$  - 8 A)で表される基の中で、 $R^{a1}$ が炭化水素基である基を「炭化水素 - スルファニルーチオカルボニル基」、 $R^{a1}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ースルファニルーチオカルボニル基」と称する。

式( $\omega$  - 9 A)で表される基の中で、 $R^{a1}$ が炭化水素基である基を「N - 炭化水素 - カルバモイル基」(具体例:N - メチルカルバモイル等の基)、 $R^{a1}$ がヘテロ環基である基を「N - N - N - N + N

式( $\omega-1$ 0A)で表される基の中で、R  $^{a1}$ 及びR  $^{b1}$ が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-カルバモイル基」(具体例:N, N-ジメチルカルバモイル等の基)、R  $^{a1}$ 及びR  $^{b1}$ がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-カルバモイル基」、R  $^{a1}$ が炭化水素基であり R  $^{b1}$ がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-置換カルバモイル基」、R  $^{a1}$ 及び R  $^{b1}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノーカルボニル基」(具体例:モルホリノカルボニル等の基)と称する。

式  $(\omega-11A)$  で表される基の中で、 $R^{\alpha 1}$ が炭化水素基である基を「N-炭化水素-チオカルバモイル基」、 $R^{\alpha 1}$ がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-チオカルバモイル基」と称する。

式 $(\omega-1\ 2\ A)$ で表される基の中で、 $R^{a\,1}$ 及び $R^{b\,1}$ が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-チオカルバモイル基」、 $R^{a\,1}$ 及び $R^{b\,1}$ がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-チオカルバモイル基」、 $R^{a\,1}$ が炭化水素基であり $R^{b\,1}$ がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-チオカルバモイル基」、 $R^{a\,1}$ 及び $R^{b\,1}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノーチオカルボニル基」と称する。

式  $(\omega-13A)$  で表される基の中で、 $R^{a1}$ が炭化水素基である基を「N-炭化水素-スルファモイル基」、 $R^{a1}$ がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-スル

ファモイル基」と称する。

式( $\omega-1$ 4A)で表される基の中で、 $R^{a1}$ 及び $R^{b1}$ が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-スルファモイル基」(具体例:N, N-ジメチルスルファモイル等の基)、 $R^{a1}$ 及び $R^{b1}$ がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)スルファモイル基」、 $R^{a1}$ が炭化水素基であり  $R^{b1}$ がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-スルファモイル基」、 $R^{a1}$ 及び $R^{b1}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノースルホニル基」(具体例:1-ピロリルスルホニル等の基)と称する。

式( $\omega-1$  5 A)で表される基の中で、R  $^{a1}$ が炭化水素基である基を「N  $^{-}$  炭化水素 $^{-}$  スルフィナモイル基」、R  $^{a1}$  がヘテロ環基である基を「N  $^{-}$  ヘテロ環 $^{-}$  スルフィナモイル基」と称する。

式 $(\omega-16A)$ で表される基の中で、 $R^{a1}$ 及び $R^{b1}$ が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-スルフィナモイル基」、 $R^{a1}$ 及び $R^{b1}$ がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-スルフィナモイル基」、 $R^{a1}$ が炭化水素基であり $R^{b1}$ がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-スルフィナモイル基」、 $R^{a1}$ 及び $R^{b1}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノースルフィニル基」と称する。

式  $(\omega-17A)$  で表される基の中で、 $R^{a1}$  が炭化水素基である基を「炭化水素 - オキシースルホニル基」、 $R^{a1}$  がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシースルホニル基」と称する。

式( $\omega-18A$ )で表される基の中で、 $R^{\alpha 1}$ が炭化水素基である基を「炭化水素 - オキシースルフィニル基」、 $R^{\alpha 1}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシースルフィニル基」と称する。

式  $(\omega-19A)$ で表される基の中で、 $R^{a1}$ 及び  $R^{b1}$ が炭化水素基である基を  $\Gamma O$ , O'-ジ (炭化水素)  $-ホスホノ基」、<math>R^{a1}$ 及び  $R^{b1}$ がヘテロ環基である基を  $\Gamma O$ , O'-ジ (ヘテロ環)  $-ホスホノ基」、<math>R^{a1}$ が炭化水素基であり  $R^{b1}$ がヘテロ環基である基を  $\Gamma O$  を表する。

式  $(\omega - 20 A)$  で表される基の中で、 $R^{a1}$ が炭化水素基である基を「炭化水素 - スルホニル基」(具体例:メタンスルホニル、ベンゼンスルホニル等の基)、 $R^{a1}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環- スルホニル基」と称する。

式  $(\omega - 21A)$  で表される基の中で、 $R^{a1}$ が炭化水素基である基を「炭化水素 - スルフィニル基」具体例:メチルスルフィニル、ベンゼンスルフィニル等の基)、  $R^{a1}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ースルフィニル基」と称する。

上記式( $\omega-1$  A)乃至( $\omega-2$  1 A)で表される基における「炭化水素」としては、上記「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。例えば、式( $\omega-1$  A)で表される「炭化水素-カルボニル基」としては、アルキル-カルボニル基、アルケニル-カルボニル基、アルキニル-カルボニル基、シクロアルキル-カルボニル基、シクロアルケニル-カルボニル基、シクロアルカンジエニル-カルボニル基、シクロアルキル-アルキル-カルボニル基等の脂肪族炭化水素-カルボニル基;アリール-カルボニル基;アラルキル-カルボニル基;架橋環式炭化水素-カルボニル基;スピロ環式炭化水素-カルボニル基;テルペン系炭化水素-カルボニル基が挙げられる。以下、式( $\omega-2$  A)乃至( $\omega-2$  1 A)で表される基も同様である。

上記式( $\omega-1$  A)乃至( $\omega-2$  1 A)で表される基における「ヘテロ環」としては、上記「ヘテロ環基」と同様の基が挙げられる。例えば、式( $\omega-1$  A)で表される「ヘテロ環ーカルボニル基」としては、例えば、単環式ヘテロアリールーカルボニル基、縮合多環式ヘテロアリールーカルボニル基、単環式非芳香族ヘテロ環ーカルボニル基、縮合多環式非芳香族ヘテロ環ーカルボニル基が挙げられる。以下、式( $\omega-2$  A)乃至( $\omega-2$  1 A)で表される基も同様である。

上記式  $(\omega-10A)$  乃至  $(\omega-16A)$  で表される基における「環状アミノ」としては、上記「環状アミノ基」と同様の基が挙げられる。

本明細書において、ある官能基について「置換基を有していてもよい」という場合には、特に言及する場合を除き、その官能基が、化学的に可能な位置に1個又は2個以上の「置換基」を有する場合があることを意味する。官能基に存在する

置換基の種類、置換基の個数、及び置換位置は特に限定されず、2個以上の置換 基が存在する場合には、それらは同一であっても異なっていてもよい。官能基に 存在する「置換基」としては、例えば、ハロゲン原子、オキソ基、チオキソ基、 ニトロ基、ニトロソ基、シアノ基、イソシアノ基、シアナト基、チオシアナト基、 イソシアナト基、イソチオシアナト基、ヒドロキシ基、スルファニル基、カルボ キシ基、スルファニルカルボニル基、オキサロ基、メソオキサロ基、チオカルボ キシ基、ジチオカルボキシ基、カルバモイル基、チオカルバモイル基、スルホ基、 スルファモイル基、スルフィノ基、スルフィナモイル基、スルフェノ基、スルフ ェナモイル基、ホスホノ基、ヒドロキシホスホニル基、炭化水素基、ヘテロ環基、 炭化水素-オキシ基、ヘテロ環-オキシ基、炭化水素-スルファニル基、ヘテロ 環ースルファニル基、アシル基、アミノ基、ヒドラジノ基、ヒドラゾノ基、ジア ゼニル基、ウレイド基、チオウレイド基、グアニジノ基、カルバモイミドイル基 (アミジノ基)、アジド基、イミノ基、ヒドロキシアミノ基、ヒドロキシイミノ基、 アミノオキシ基、ジアゾ基、セミカルバジノ基、セミカルバゾノ基、アロファニ ル基、ヒダントイル基、ホスファノ基、ホスホロソ基、ホスホ基、ボリル基、シ リル基、スタニル基、セラニル基、オキシド基等を挙げることができる。 上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」が2個以上存在す る場合、該2個以上の置換基は、それらが結合している原子と一緒になって環式

上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」が2個以上存在する場合、該2個以上の置換基は、それらが結合している原子と一緒になって環式基を形成してもよい。このような環式基には、環系を構成する原子(環原子)として、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子等から選択されたヘテロ原子1ないし3種が1個以上含有されていてもよく、該環上には1個以上の置換基が存在していてもよい。該環は、単環式又は縮合多環式のいずれであってもよく、芳香族又は非芳香族のいずれであってもよい。

上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」は、該置換基上の 化学的に可能な位置で、上記「置換基」によって置換されていてもよい。置換基 の種類、置換基の個数、及び置換位置は特に限定されず、2個以上の置換基で置 換される場合には、それらは同一であっても異なっていてもよい。そのような例

として、例えば、ハロゲン化アルキルーカルボニル基(具体例:トリフルオロアセチル等の基)、ハロゲン化アルキルースルホニル基(具体例:トリフルオロメタンスルホニル等の基)、アシルーオキシ基、アシルースルファニル基、Nー炭化水素基ーアミノ基、N,Nージ(炭化水素)ーアミノ基、Nーヘテロ環ーアミノ基、Nー炭化水素ーNーヘテロ環ーアミノ基、アシルーアミノ基、ジ(アシル)ーアミノ基等の基が挙げられる。また、上記「置換基」上での「置換」は複数次にわたって繰り返されてもよい。

「アシルーオキシ基」としては、「ヒドロキシ基」の水素原子が「アシル基」で置換された基が挙げられ、例えば、ホルミルオキシ基、グリオキシロイルオキシ基、チオホルミルオキシ基、カルバモイルオキシ基、チオカルバモイルオキシ基、スルファモイルオキシ基、スルフィナモイルオキシ基、カルボキシオキシ基、スルホオキシ基、ホスホノオキシ基、及び下記式:

(式中、R<sup>a2</sup>及びR<sup>b2</sup>は、同一又は異なって、炭化水素基、又はヘテロ環基を表すか、あるいはR<sup>a2</sup>及びR<sup>b2</sup>が一緒になって、それらが結合している窒素原子と 共に環状アミノ基を表す)で表される基が挙げられる。

上記「アシルーオキシ基」の定義において、

式( $\omega-1$  B)で表される基の中で、 $R^{*2}$ が炭化水素基である基を「炭化水素 - カルボニルーオキシ基」(具体例:アセトキシ、ベンゾイルオキシ等の基)、 $R^{*2}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーカルボニルーオキシ基」と称する。

式  $(\omega - 2B)$  で表される基の中で、 $R^{2}$  が炭化水素基である基を「炭化水素ーオキシーカルボニルーオキシ基」、 $R^{2}$  がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーカルボニルーオキシ基」と称する。

式( $\omega$  -3 B)で表される基の中で、R  $^{a}$   $^{2}$  が炭化水素基である基を「炭化水素 - カルボニルーカルボニルーオキシ基」、R  $^{a}$   $^{2}$  がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーカルボニルーカルボニルーオキシ基」と称する。

式( $\omega$  -4 B)で表される基の中で、 $R^{*2}$ が炭化水素基である基を「炭化水素 - オキシーカルボニルーカルボニルーオキシ基」、 $R^{*2}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーカルボニルーカルボニルーオキシ基」と称する。

式( $\omega$  – 5 B)で表される基の中で、R  $^{a}$   $^{2}$  が炭化水素基である基を「炭化水素 – スルファニルーカルボニルーオキシ基」、R  $^{a}$   $^{2}$  がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ースルファニルーカルボニルーオキシ基」と称する。

式( $\omega$  - 7 B)で表される基の中で、R  $^a$   $^2$  が炭化水素基である基を「炭化水素 - オキシーチオカルボニルーオキシ基」、R  $^a$   $^2$  がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーチオカルボニルーオキシ基」と称する。

式( $\omega$  - 8 B)で表される基の中で、 $R^{a2}$ が炭化水素基である基を「炭化水素 - スルファニルーチオカルボニルーオキシ基」、 $R^{a2}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ースルファニルーチオカルボニルーオキシ基」と称する。

式( $\omega$  - 9 B)で表される基の中で、 $R^{*2}$ が炭化水素基である基を「N - 炭化水素 - カルバモイルーオキシ基」、 $R^{*2}$ がヘテロ環基である基を「N - ヘテロ環 - カルバモイルーオキシ基」と称する。

式  $(\omega-1\ 1\ B)$  で表される基の中で、 $R^{a\ 2}$ が炭化水素基である基を「N-炭化水素-チオカルバモイル-オキシ基」、 $R^{a\ 2}$ がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-チオカルバモイル-オキシ基」と称する。

式 $(\omega-12B)$ で表される基の中で、 $R^{a2}$ 及び $R^{b2}$ が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-チオカルバモイルーオキシ基」、 $R^{a2}$ 及び $R^{b2}$ がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-チオカルバモイルーオキシ基」、 $R^{a2}$ が炭化水素基であり  $R^{b2}$ がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環ーチオカルバモイルーオキシ基」、 $R^{a2}$ 及び $R^{b2}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノーチオカルボニルーオキシ基」と称する。

式  $(\omega-13B)$  で表される基の中で、 $R^{a^2}$ が炭化水素基である基を「N-炭化水素ースルファモイルーオキシ基」、 $R^{a^2}$ がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環ースルファモイルーオキシ基」と称する。

式 $(\omega-14B)$ で表される基の中で、 $R^*$ <sup>2</sup>及び $R^*$ <sup>2</sup>が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-スルファモイルーオキシ基」、 $R^*$ <sup>2</sup>及び $R^*$ <sup>2</sup>がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-スルファモイルーオキシ基」、 $R^*$ <sup>2</sup>が炭化水素基であり $R^*$ <sup>2</sup>がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-スルファモイルーオキシ基」、 $R^*$ <sup>2</sup>及び $R^*$ <sup>2</sup>が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノースルホニルーオキシ基」と称する。

式  $(\omega-15B)$  で表される基の中で、 $R^{2}$ が炭化水素基である基を「N-炭化水素-スルフィナモイル-オキシ基」、 $R^{2}$ がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-スルフィナモイル-オキシ基」と称する。

式 $(\omega-16B)$ で表される基の中で、 $R^{a^2}$ 及び $R^{b^2}$ が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-スルフィナモイルーオキシ基」、 $R^{a^2}$ 及び $R^{b^2}$ がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-スルフィナモイルーオキシ基」、 $R^{a^2}$ が炭化水素基であり $R^{b^2}$ がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環ースルフィナモイルーオキシ基」、 $R^{a^2}$ 及び $R^{b^2}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノースルフィニルーオキシ基」と称する。

式  $(\omega-17B)$  で表される基の中で、 $R^{2}$ が炭化水素基である基を「炭化水素 - オキシースルホニルーオキシ基」、 $R^{2}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシースルホニルーオキシ基」と称する。

式( $\omega-18B$ )で表される基の中で、R  $^{2}$ が炭化水素基である基を「炭化水素 - オキシースルフィニルーオキシ基」、R  $^{2}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環 - オキシースルフィニルーオキシ基」と称する。

式  $(\omega - 19B)$  で表される基の中で、 $R^{a2}$ 及び  $R^{b2}$ が炭化水素基である基を「O,O'ージ(炭化水素) -ホスホノーオキシ基」、 $R^{a2}$ 及び  $R^{b2}$ がヘテロ環基である基を「O,O'ージ(ヘテロ環) -ホスホノーオキシ基」、 $R^{a2}$ が炭化水素基であり  $R^{b2}$ がヘテロ環基である基を「O一炭化水素置換-O'ーヘテロ環置換ホスホノーオキシ基」と称する。

式  $(\omega - 20B)$  で表される基の中で、 $R^{2}$ が炭化水素基である基を「炭化水素 - スルホニルーオキシ基」、 $R^{2}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環 - スルホニルーオキシ基」と称する。

上記式( $\omega-1$  B)乃至( $\omega-2$  1 B)で表される基における「炭化水素」としては、上記「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。例えば、式( $\omega-1$  B)で表される「炭化水素-カルボニルーオキシ基」としては、アルキル-カルボニルーオキシ基、アルキニル-カルボニルーオキシ基、シクロアルケニル-カルボニルーオキシ基、シクロアルケニル-カルボニルーオキシ基、シクロアルケニル-カルボニルーオキシ基、シクロアルカンジエニル-カルボニル-オキシ基、シクロアルカンジエニル-カルボニル-オキシ基、シクロアルキル-カルボニル-オキシ基等の脂肪族炭化水素-カルボニル-オキシ基;アリール-カルボニル-オキシ基;アラルキル-カルボニル-オキシ基;架橋環式炭化水素-カルボニル-オキシ基;スピロ環式炭化水素-カルボニル-オキシ基;テルペン系炭化水素-カルボニル-オキシ基が挙げられる。以下、式( $\omega-2$  B)乃至( $\omega-2$  1 B)で表される基も同様である。

上記式( $\omega-1$  B)乃至( $\omega-2$  1 B)で表される基における「ヘテロ環」としては、上記「ヘテロ環基」と同様の基が挙げられる。例えば、式( $\omega-1$  B)で表される「ヘテロ環ーカルボニル基」としては、例えば、単環式ヘテロアリールーカルボニル基、縮合多環式ヘテロアリールーカルボニル基、単環式非芳香族ヘテロ環ーカルボニル基、縮合多環式非芳香族ヘテロ環ーカルボニル基が挙げられる。以下、式( $\omega-2$  B)乃至( $\omega-2$  1 B)で表される基も同様である。

上記式  $(\omega-10B)$  乃至  $(\omega-16B)$  で表される基における「環状アミノ」としては、上記「環状アミノ基」と同様の基が挙げられる。

上記「アシルーオキシ基」、「炭化水素ーオキシ基」、及び「ヘテロ環ーオキシ基」 を総称して、「置換オキシ基」と称する。また、これら「置換オキシ基」と「ヒドロキシ基」を総称して、「置換基を有していてもよいヒドロキシ基」と称する。

「アシルースルファニル基」としては、「スルファニル基」の水素原子が「アシル基」で置換された基が挙げられ、例えば、ホルミルスルファニル基、グリオキシロイルスルファニル基、チオホルミルスルファニル基、カルバモイルスルファニル基、スルファモイルスルファニル基、スルフィナモイルスルファニル基、カルボキシスルファニル基、スルホスルファニル

基、ホスホノスルファニル基、及び下記式:

(式中、R<sup>a3</sup>及びR<sup>b3</sup>は、同一又は異なって、置換基を有していてもよい炭化水素基、又は置換基を有していてもよいヘテロ環基を表すか、あるいはR<sup>a3</sup>及びR<sup>b3</sup>が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に、置換基を有していて

もよい環状アミノ基を表す)で表される基が挙げられる。

上記「アシルースルファニル基」の定義において、

式( $\omega-1$  C)で表される基の中で、 $R^{a3}$ が炭化水素基である基を「炭化水素  $\pi$  カルボニルースルファニル基」、 $\pi^{a3}$  がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーカルボニルースルファニル基」と称する。

式(ω-3C)で表される基の中で、R<sup>3</sup>が炭化水素基である基を「炭化水素-カルボニル-カルボニル-スルファニル基」、R<sup>3</sup>がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-カルボニル-カルボニル-スルファニル基」と称する。

式  $(\omega - 4 C)$  で表される基の中で、 $R^{a3}$ が炭化水素基である基を「炭化水素ーオキシーカルボニルーカルボニルースルファニル基」、 $R^{a3}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーカルボニルーカルボニルースルファニル基」と称する。

式( $\omega$  - 7 C)で表される基の中で、 $R^{a3}$ が炭化水素基である基を「炭化水素 - オキシーチオカルボニルースルファニル基」、 $R^{a3}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーチオカルボニルースルファニル基」と称する。

式( $\omega$  - 8 C)で表される基の中で、R  $^a$   $^3$  が炭化水素基である基を「炭化水素 - スルファニルーチオカルボニルースルファニル基」、R  $^a$   $^3$  がヘテロ環基である基を 「ヘテロ環ースルファニルーチオカルボニルースルファニル基」と称する。

式  $(\omega - 9C)$  で表される基の中で、 $R^{a3}$ が炭化水素基である基を「N - 炭化水

素 - カルバモイルースルファニル基」、 $R^{a3}$ がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環ーカルバモイルースルファニル基」と称する。

式( $\omega-1$ 1 C)で表される基の中で、R  $^{a3}$ が炭化水素基である基を「N  $^{-}$ 炭化水素  $^{-}$  チオカルバモイルースルファニル基」、R  $^{a3}$  がヘテロ環基である基を「N  $^{-}$  - ヘテロ環  $^{-}$  チオカルバモイルースルファニル基」と称する。

式( $\omega-1$ 3C)で表される基の中で、 $R^{a3}$ が炭化水素基である基を「N-炭化水素-スルファモイルースルファニル基」、 $R^{a3}$ がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-スルファモイルースルファニル基」と称する。

式  $(\omega-14C)$ で表される基の中で、 $R^{a3}$ 及び $R^{b3}$ が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素) -スルファモイルースルファニル基」、 $R^{a3}$ 及び $R^{b3}$ がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環) - スルファモイルースルフィニル基」、 $R^{a3}$ が炭化水素基であり  $R^{b3}$ がヘテロ環基である基を「N 一炭化水素 - N 一ヘテロ環スルファモイルースルファニル基」、 $R^{a3}$ 及び $R^{b3}$ が一緒になって、それら

が結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノースルホニルースルファニル基」と称する。

式  $(\omega-15C)$  で表される基の中で、 $R^{a3}$ が炭化水素基である基を「N-炭化水素-スルフィナモイル-スルファニル基」、 $R^{a3}$ がヘテロ環基である基を「 $N^{a3}$ のでは、 $R^{a3}$ のである基を「 $R^{a3}$ のでは、 $R^$ 

式 $(\omega-16C)$ で表される基の中で、 $R^{a3}$ 及び $R^{b3}$ が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-スルフィナモイル-スルファニル基」、 $R^{a3}$ 及び $R^{b3}$ がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-スルフィナモイル-スルファニル基」、 $R^{a3}$ が炭化水素基であり $R^{b3}$ がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-スルフィナモイル-スルファニル基」、 $R^{a3}$ 及び $R^{b3}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノスルファニル-スルファニルースルファニル基」と称する。

式( $\omega-1$ 7C)で表される基の中で、 $R^{a3}$ が炭化水素基である基を「炭化水素 - オキシースルホニルースルファニル基」、 $R^{a3}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシースルホニルースルファニル基」と称する。

式  $(\omega-18C)$  で表される基の中で、 $R^{a3}$ が炭化水素基である基を「炭化水素 - オキシースルフィニルースルファニル基」、 $R^{a3}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシースルフィニルースルファニル基」と称する。

式  $(\omega-19C)$  で表される基の中で、 $R^{a3}$ 及び  $R^{b3}$ が炭化水素基である基を「O,O'-ジ(炭化水素)-ホスホノースルファニル基」、 $R^{a3}$ 及び  $R^{b3}$ がヘテロ環基である基を「O,O'-ジ(ヘテロ環)-ホスホノースルファニル基」、 $R^{a3}$ が炭化水素基であり  $R^{b3}$ がヘテロ環基である基を「O-炭化水素-O'-ヘテロ環ーホスホノースルファニル基」と称する。

式 (ω-21C) で表される基の中で、R \*3 が炭化水素基である基を「炭化水素

ースルフィニルースルファニル基」、R \* 3 がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ースルフィニルースルファニル基」と称する。

上記式( $\omega-1$  C)乃至( $\omega-2$  1 C)で表される基における「炭化水素」としては、上記「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。例えば、式( $\omega-1$  C)で表される「炭化水素ーカルボニルースルファニル基」としては、アルキルーカルボニルースルファニル基、アルケニルーカルボニルースルファニル基、アルキニルーカルボニルースルファニル基、シクロアルキルーカルボニルースルファニル基、シクロアルカンジェニルーカルボニルースルファニル基、シクロアルカンジェニルーカルボニルースルファニル基、シクロアルカルボニルースルファニル基、シクロアルカルボニルースルファニル基、アリールーカルボニルースルファニル基;アリールーカルボニルースルファニル基;アラルキルーカルボニルースルファニル基;架橋環式炭化水素ーカルボニルースルファニル基;スピロ環式炭化水素ーカルボニルースルファニル基が挙げられる。以下、式( $\omega-2$  C)乃至( $\omega-2$  1 C)で表される基も同様である。

上記式( $\omega-1$  C)乃至( $\omega-2$  1 C)で表される基における「ヘテロ環」としては、上記「ヘテロ環基」と同様の基が挙げられる。例えば、式( $\omega-1$  C)で表される「ヘテロ環ーカルボニルースルファニル基」としては、例えば、単環式ヘテロアリールーカルボニルースルファニル基、縮合多環式ヘテロアリールーカルボニルースルファニル基、単環式非芳香族ヘテロ環ーカルボニルースルファニル基、単環式非芳香族ヘテロ環ーカルボニルースルファニル基が挙げられる。以下、式( $\omega-2$  C)乃至( $\omega-2$  1 C)で表される基も同様である。

上記式  $(\omega-10C)$  乃至  $(\omega-16C)$  で表される基における「環状アミノ」 としては、上記「環状アミノ基」と同様の基が挙げられる。

上記「アシルースルファニル基」、「炭化水素ースルファニル基」、及び「ヘテロ環ースルファニル基」を総称して、「置換スルファニル基」と称する。また、これら「置換スルファニル基」と「スルファニル基」を総称して、「置換基を有していてもよいスルファニル基」と称する。

「N一炭化水素-アミノ基」としては、「アミノ基」の1つの水素原子が、「炭化水素基」で置換された基が挙げられ、例えば、Nーアルキルーアミノ基、Nーアルケニルーアミノ基、Nーシクロアルキルーアミノ基、Nーシクロアルキルーアミノ基、Nーシクロアルキルーアミノ基、Nーアリールーアミノ基、Nーアラルキルーアミノ基等が挙げられる。

「N-Pルキルーアミノ基」としては、例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、n-プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、n-プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、n-プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、n-ペンチルアミノ、イソペンチルアミノ、n-ペンチルアミノ、n-ペンチルアミノ、n-ペンチルアミノ、n-ペンチルアミノ、n-ペンチルアミノ、n-ペンチルアミノ、n-ペンチルプロピル)アミノ、n-ペンチルアミノ、n-ペンチルプロピル)アミノ、n-ペンチルアミノ、n-ペンチルアミノ、n-ペンチル アミノ、n-ペンチル アミノ、n-ペンチル アミノ、n-ペンチル アミノ、n-ペンチル アミノ、n-ペンチル アミノ、n-0、n-0、n-0、n-0、n-0、n-0、n-0、n-0、n-1、n-1、n-1、n-1、n-1、n-2、n-2、n-3 n-3 n-3

「N-rルケニルーアミノ基」としては、例えば、ビニルアミノ、(プロパー1ーエンー1ーイル) アミノ、アリルアミノ、イソプロペニルアミノ、(ブター1ーエンー1ーイル) アミノ、(ブター3ーエンー1ーイル) アミノ、(ブター3ーエンー1ーイル) アミノ、(2ーメチルプロパー2ーエンー1ーイル) アミノ、(1ーメチルプロパー2ーエンー1ーイル) アミノ、(ペンター1ーエンー1ーイル) アミノ、(ペンター3ーエンー1ーイル) アミノ、(ペンター3ーエンー1ーイル) アミノ、(ペンター4ーエンー1ーイル) アミノ、(ペンター3ーエンー1ーイル)

1ーイル)アミノ、(3ーメチルブター3ーエンー1ーイル)アミノ、(ヘキサー 1-エン-1-イル) アミノ、(ヘキサ-2-エン-1-イル) アミノ、(ヘキサ -3-エン-1-イル) アミノ、(ヘキサ-4-エン-1-イル) アミノ、(ヘキ サー5-xエンー1-xイル) アミノ、(4-xチルペンター3-xエンー1-xイル) ア ミノ、(4-メチルペンタ-3-エン-1-イル)アミノ、(ヘプタ-1-エン-1ーイル)アミノ、(ヘプター6ーエンー1ーイル)アミノ、(オクター1ーエン -1-イル)アミノ、(オクター7-エン-1-イル)アミノ、(ノナ-1-エン -1ーイル)アミノ、(ノナー8ーエンー1ーイル)アミノ、(デカー1ーエンー 1ーイル)アミノ、(デカー9ーエンー1ーイル)アミノ、(ウンデカー1ーエン -1-イル)アミノ、(ウンデカー10-エン-1-イル)アミノ、(ドデカー1 ーエンー1ーイル)アミノ、(ドデカー11ーエンー1ーイル)アミノ、(トリデ カー1ーエンー1ーイル)アミノ、(トリデカー12ーエンー1ーイル)アミノ、 (テトラデカー1-エンー1-イル) アミノ、(テトラデカー13-エンー1-イ ル) アミノ、(ペンタデカー1ーエンー1ーイル) アミノ、(ペンタデカー14ー エンー1-1ル)アミノ等の $C_2$ ~ $C_{15}$ の直鎖状又は分枝鎖状のN-アルケニル ーアミノ基が挙げられる。

「N-rルキニルーアミノ基」としては、例えば、エチニルアミノ、(プロパー1ーインー1ーイル)アミノ,(プロパー2ーインー1ーイル)アミノ,(ブター1ーインー1ーイル)アミノ、(ブター3ーインー1ーイル)アミノ、(1ーメチルプロパー2ーインー1ーイル)アミノ、(ペンター1ーインー1ーイル)アミノ、(ペンター4ーインー1ーイル)アミノ、(ペンター4ーインー1ーイル)アミノ、(ヘキサー5ーインー1ーイル)アミノ、(ヘプター1ーインー1ーイル)アミノ、(オクター7ーインー1ーイル)アミノ、(オクター7ーインー1ーイル)アミノ、(オクター7ーインー1ーイル)アミノ、(ナー8ーインー1ーイル)アミノ、(ブカー9ーインー1ーイル)アミノ、(ヴカー1ーインー1ーイル)アミノ、(ヴンデカー10ーインー1ーイル)アミノ、(ヴンデカー10ーインー1ーイル)アミノ、(ヴンデカー10ーインー1ーイル)アミノ、

(ドデカー11ーインー1-イル)アミノ、(トリデカー1-インー1-イル)アミノ、(トリデカー12ーインー1-イル)アミノ、(テトラデカー1-インー1-イル)アミノ、(テトラデカー13ーインー1-イル)アミノ、(ペンタデカー1-インー1-イル)アミノ、(ペンタデカー14ーインー1-イル)アミノ等の $C_2 \sim C_{15}$ の直鎖状又は分枝鎖状のN-アルキニルーアミノ基が挙げられる。

「N-シクロアルキルーアミノ基」としては、例えば、シクロプロピルアミノ、シクロブチルアミノ、シクロペンチルアミノ、シクロヘキシルアミノ、シクロヘプチルアミノ、シクロオクチルアミノ等の $C_3\sim C_8$ のN-シクロアルキルーアミノ基が挙げられる。

「N-シクロアルキルーアルキルーアミノ基」としては、例えば、(シクロプロピルメチル)アミノ、(1-シクロプロピルエチル)アミノ、(2-シクロプロピルエチル)アミノ、(4-シクロプロピルプロピル)アミノ、(4-シクロプロピルブロピル)アミノ、(4-シクロプロピルブチル)アミノ、(5-シクロプロピルペンチル)アミノ、(6-シクロプロピルヘキシル)アミノ、(5-シクロブチルメチル)アミノ、(5-0クログロピルハンチル)アミノ、(5-0クロベンチルメチル)アミノ、(5-0クロベンチルメチル)アミノ、(5-0クロベンチルメチル)アミノ、(5-0クロベンチルメチル)アミノ、(5-0クロベキシルメチル)アミノ、(5-00ロベプチルメチル)アミノ、(5-00ロベプチルメチル)アミノ、(5-00ロベプチルメチル)アミノ、(5-00ロベプチルメチル)アミノ、(5-00ロベアチルメチル)アミノ、(5-00ロベアチルメチル)アミノ、(5-00ロベアチルメチル)アミノ、(5-00ロベアチルメチル)アミノ、(5-00ロベアチルメチル)アミノ、(5-00ロベアチルメチル)アミノ、(5-00ロベアチルメチル)アミノ、(5-00ロベアチルベキシル)アミノ等の5-00に5-0に5-0のに

「N-アリール-アミノ基」としては、例えば、フェニルアミノ、1-ナフチルアミノ、2-ナフチルアミノ、アントリルアミノ、フェナントリルアミノ、アセナフチレニルアミノ等の $C_6\sim C_{14}$ のN-モノ-アリールアミノ基が挙げられる。「N-アラルキル-アミノ基」としては、例えば、ベンジルアミノ、(1-ナフチルメチル)アミノ、(2-ナフチルメチル)アミノ、(7 エナントレニルメチル)アミノ、(7 エナントレニルメチル)アミノ、(7 エナントレニルメチル)アミノ、(7 エナントレニルメチル)アミノ、(7 エナントレニルメチル)アミノ、(7 エナントレニルメチル)アミノ、(7 エナントレニルメチル)アミノ、(7 エカントレニルメチル)アミノ、(7 エカントレニルメチル)アニ

ミノ、 $(1-(1-t)75\mu)$  エチル)アミノ、 $(1-(2-t)75\mu)$  エチル)アミノ、 $(2-(1-t)75\mu)$  エチル)アミノ、 $(2-(2-t)75\mu)$  エチル)アミノ、 $(3-(1-t)75\mu)$  アミノ、 $(3-(1-t)75\mu)$  アミノ、 $(3-(1-t)75\mu)$  アミノ、 $(3-(2-t)75\mu)$  アミノ、 $(4-(2-t)75\mu)$  アミノ、 $(4-(1-t)75\mu)$  アミノ、 $(4-(2-t)75\mu)$  アミノ、 $(5-(1-t)75\mu)$  アミノ、 $(5-(2-t)75\mu)$  アミノ、 $(5-(1-t)75\mu)$  アミノ、 $(6-(2-t)75\mu)$  ペンチル)アミノ、 $(6-(2-t)75\mu)$  ペンチル)アミノ、 $(6-(2-t)75\mu)$  ペンチル)アミノ、 $(6-(2-t)75\mu)$  ペキシル)アミノ等の $(7-(2-t)75\mu)$  ペキシル)アミノ、 $(6-(2-t)75\mu)$  ペキシル)アミノ等の $(7-(2-t)75\mu)$  ペキシル)アミノ基が挙げられる。

「N, N-ジ(炭化水素)ーアミノ基」としては、「アミノ基」の2つの水素原子が、「炭化水素基」で置換された基が挙げられ、例えば、N, N-ジメチルアミノ、N, N-ジエチルアミノ、NーエチルーN-メチルアミノ、N, N-ジーn-プロピルアミノ、N, N-ジイソプロピルアミノ、NーアリルーN-メチルアミノ、Nープロパー2ーインー1ーイル)ーN-メチルアミノ、N, N-ジシクロへキシルアミノ、NーシクロへキシルーN-メチルアミノ、Nーシクロへキシルメチルアミノ、Nージチルアミノ、Nージースチルアミノ、Nーメチルアミノ、Nーメチルアミノ、NーズチルーNーフェニルアミノ、N, Nージベンジルアミノ、NーベンジルーNーメチルアミノ等の基が挙げられる。

「 $N- \sim$  テロ環ーアミノ基」としては、「アミノ基」の1 つ水素原子が、「 $\sim$  テロ環基」で置換された基が挙げられ、例えば、(3- ピロリジニル) アミノ、(4- ピペリジニル) アミノ、(2- テトラヒドロピラニル) アミノ、(3- インドリニル) アミノ、(4- クロマニル) アミノ、(3- チェニル) アミノ、(3- ピリジル) アミノ、(3- キノリル) アミノ、(5- インドリル) アミノ等の基が挙げられる。

N-(3-ピリジル) アミノ、N-メチル-N-(3-キノリル) アミノ等の基が挙げられる。

「アシルーアミノ基」としては、「アミノ基」の1つの水素原子が、「アシル基」で置換された基が挙げられ、例えば、ホルミルアミノ基、グリオキシロイルアミノ基、チオホルミルアミノ基、カルバモイルアミノ基、チオカルバモイルアミノ基、スルファモイルアミノ基、スルフィナモイルアミノ基、カルボキシアミノ基、スルホアミノ基、ホスホノアミノ基、及び下記式:

(式中、R<sup>a4</sup>及びR<sup>b4</sup>は、同一又は異なって、置換基を有していてもよい炭化水素基、又は置換基を有していてもよいヘテロ環基を表すか、あるいはR<sup>a4</sup>及びR<sup>b4</sup>が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に、置換基を有していてもよい環状アミノ基を表す)で表される基が挙げられる。

上記「アシルーアミノ基」の定義において、

式( $\omega-1$  D)で表される基の中で、 $R^{4}$ が炭化水素基である基を「炭化水素 -1 カルボニルーアミノ基」、 $R^{4}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーカルボニルーアミノ基」と称する。

式( $\omega-2D$ )で表される基の中で、 $R^{4}$ が炭化水素基である基を「炭化水素ーオキシーカルボニルーアミノ基」、 $R^{4}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーカルボニルーアミノ基」と称する。

式( $\omega$  - 3 D)で表される基の中で、 $R^{a4}$ が炭化水素基である基を「炭化水素 - カルボニルーカルボニルーアミノ基」、 $R^{a4}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環 - カルボニルーカルボニルーアミノ基」と称する。

式( $\omega-4D$ )で表される基の中で、 $R^{*4}$ が炭化水素基である基を「炭化水素ーオキシーカルボニルーカルボニルーアミノ基」、 $R^{*4}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーカルボニルーカルボニルーアミノ基」と称する。

式( $\omega-5D$ )で表される基の中で、 $R^{4}$ が炭化水素基である基を「炭化水素-スルファニルーカルボニルーアミノ基」、 $R^{4}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ースルファニルーカルボニルーアミノ基」と称する。

式( $\omega-6D$ )で表される基の中で、 $R^4$ が炭化水素基である基を「炭化水素-チオカルボニルーアミノ基」、 $R^4$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーチオカルボニルーアミノ基」と称する。

式( $\omega$  - 7 D)で表される基の中で、 $R^{a4}$ が炭化水素基である基を「炭化水素 - オキシーチオカルボニルーアミノ基」、 $R^{a4}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーチオカルボニルーアミノ基」と称する。

式( $\omega$  - 8 D)で表される基の中で、 $R^{4}$ が炭化水素基である基を「炭化水素 - スルファニルーチオカルボニルーアミノ基」、 $R^{4}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ースルファニルーチオカルボニルーアミノ基」と称する。.

式( $\omega-9$  D)で表される基の中で、 $R^{4}$ が炭化水素基である基を「N-炭化水素ーカルバモイル基」、 $R^{4}$ がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-カルバモ

イルーアミノ基」と称する。

式( $\omega$ -10D)で表される基の中で、R \* 4及びR b 4が炭化水素基である基を「N, N - ジ(炭化水素) - カルバモイルーアミノ基」、R \* 4及びR b 4がヘテロ環基である基を「N, N - ジ(ヘテロ環) - カルバモイルーアミノ基」、R \* 4が炭化水素基でありR b 4 がヘテロ環基である基を「N - 炭化水素- N - へテロ環- カルバモイルーアミノ基」、R \* 4及びR b 4 が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノーカルボニルーアミノ基」と称する。

式( $\omega-1$ 1D)で表される基の中で、 $R^{4}$ が炭化水素基である基を「N-炭化水素-チオカルバモイル-アミノ基」、 $R^{4}$ がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-チオカルバモイル-アミノ基」と称する。

式( $\omega-1$ 2D)で表される基の中で、 $R^{a4}$ 及び $R^{b4}$ が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-チオカルバモイルーアミノ基」、 $R^{a4}$ 及び $R^{b4}$ がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-チオカルバモイルーアミノ基」、 $R^{a4}$ が炭化水素基であり  $R^{b4}$ がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環ーチオカルバモイルーアミノ基」、 $R^{a4}$ 及び  $R^{b4}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノーチオカルボニルーアミノ基」と称する。

式( $\omega-1$ 3D)で表される基の中で、 $R^{4}$ が炭化水素基である基を「N-炭化水素-スルファモイル-アミノ基」、 $R^{4}$ がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環ースルファモイル-アミノ基」と称する。

式( $\omega-1$ 4D)で表される基の中で、 $R^{a4}$ 及び $R^{b4}$ が炭化水素基である基を「ジ(炭化水素)スルファモイルーアミノ基」、 $R^{a4}$ 及び $R^{b4}$ がヘテロ環基である基を「N,Nージ(ヘテロ環)スルファモイルーアミノ基」、 $R^{a4}$ が炭化水素基であり $R^{b4}$ がヘテロ環基である基を「Nー炭化水素-Nーヘテロ環-スルファモイルーアミノ基」、 $R^{a4}$ 及び $R^{b4}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノースルホニルーアミノ基」と称する。

式( $\omega-15D$ )で表される基の中で、 $R^{a4}$ が炭化水素基である基を「N-炭化水素 -スルフィナモイルーアミノ基」、 $R^{a4}$ がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環ースルフィナモイルーアミノ基」と称する。;式( $\omega-16D$ )で表される基の中で、 $R^{a4}$ 及び $R^{b4}$ が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-スルフィナモイルーアミノ基」、 $R^{a4}$ 及び $R^{b4}$ がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-スルフィナモイルーアミノ基」、 $R^{a4}$ 及び $R^{b4}$ がヘテロ環基である基を「N-炭化水素上であり $R^{b4}$ がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環ースルフィナモイルーアミノ基」、 $R^{a4}$ 及び $R^{b4}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノースルフィニルーアミノ基」と称する。

式( $\omega-17D$ )で表される基の中で、 $R^{4}$ が炭化水素基である基を「炭化水素 - オキシースルホニルーアミノ基」、 $R^{4}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ー オキシースルホニルーアミノ基」と称する。

式( $\omega-18D$ )で表される基の中で、 $R^{44}$ が炭化水素基である基を「炭化水素 - オキシースルフィニルーアミノ基」、 $R^{44}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環 - オキシースルフィニルーアミノ基」と称する。

式( $\omega-19D$ )で表される基の中で、 $R^{a4}$ 及び $R^{b4}$ が炭化水素基である基を「O, O' -ジ (炭化水素) -ホスホノーアミノ基」、 $R^{a4}$ 及び $R^{b4}$ がヘテロ環基である基を「O, O' -ジ (ヘテロ環) -ホスホノーアミノ基」、 $R^{a4}$ が炭化水素基であり $R^{b4}$ がヘテロ環基である基を「O一炭化水素-O' -ヘテロ環ーホスホノーアミノ基」と称する。

式( $\omega-20D$ )で表される基の中で、 $R^{44}$ が炭化水素基である基を「炭化水素 - スルホニルーアミノ基」、 $R^{44}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環- スルホニルーアミノ基」と称する。

式( $\omega-2$ 1D)で表される基の中で、 $R^{4}$ が炭化水素基である基を「炭化水素 -スルフィニルーアミノ基」、 $R^{4}$ がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-スルフィニルーアミノ基」と称する。

上記式  $(\omega-1D)$  乃至  $(\omega-21D)$  で表される基における「炭化水素」とし

ては、上記「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。例えば、式( $\omega-1$  D)で表される「炭化水素- カルボニル- アミノ基」としては、アルキル- カルボニル- アミノ基、アルケニル- カルボニル- アミノ基、アルケニル- カルボニル- アミノ基、シクロアルキル- カルボニル- アミノ基、シクロアルキル- カルボニル- アミノ基、シクロアルカンジエニル- カルボニル- アミノ基、シクロアルカンジエニル- カルボニル- アミノ基、シクロアルカンジエニル- カルボニル- アミノ基、アリール- カルボニル- アミノ基;アラルキル- カルボニル- アミノ基;アリール- カルボニル- アミノ基;スピロ環式炭化水素- カルボニル- アミノ基;テルペン系炭化水素- カルボニル- アミノ基が挙げられる。以下、式( $\omega$  - 2 D)乃至( $\omega-$  2 1 D)で表される基も同様である。

上記式( $\omega-1$  D)乃至( $\omega-2$  1 D)で表される基における「ヘテロ環」としては、上記「ヘテロ環基」と同様の基が挙げられる。例えば、式( $\omega-1$  D)で表される「ヘテロ環ーカルボニルーアミノ基」としては、例えば、単環式ヘテロアリールーカルボニルーアミノ基、縮合多環式ヘテロアリールーカルボニルーアミノ基、単環式非芳香族ヘテロ環ーカルボニルーアミノ基、縮合多環式非芳香族ヘテロ環ーカルボニルーアミノ基が挙げられる。以下、式( $\omega-2$  D)乃至( $\omega-2$  1 D)で表される基も同様である。

上記式( $\omega-10D$ )乃至( $\omega-16D$ )で表される基における「環状アミノ」としては、上記「環状アミノ基」と同様の基が挙げられる。

「ジ (アシル) - アミノ基」としては、「アミノ基」の2つの水素原子が、上記「置換基を有していてもよい」の「置換基」の定義における「アシル基」で置換された基が挙げられ、例えば、ジ (ホルミル) - アミノ基、ジ (グリオキシロイル) - アミノ基、ジ (チオホルミル) - アミノ基、ジ (カルバモイル) - アミノ基、ジ (チオカルバモイル) - アミノ基、ジ (スルファモイル) - アミノ基、ジ (スルフィナモイル) - アミノ基、ジ (カルボキシ) - アミノ基、ジ (スルホ) - アミノ基、ジ (ホスホノ) - アミノ基、及び下記式:

$$\begin{array}{c} -N \begin{pmatrix} c - R^{a5} \\ \parallel & 0 \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 1 \, E) \,, \qquad -N \begin{pmatrix} c - C - C - R^{a5} \\ \parallel & \parallel & 0 \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 2 \, E) \,, \\ -N \begin{pmatrix} c - C - R^{a5} \\ \parallel & \parallel & 0 \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 3 \, E) \,, \qquad -N \begin{pmatrix} c - C - C - O - R^{a5} \\ \parallel & \parallel & 0 \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 4 \, E) \,, \\ -N \begin{pmatrix} c - S - R^{a5} \\ \parallel & 0 \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 5 \, E) \,, \qquad -N \begin{pmatrix} c - R^{a5} \\ \parallel & 0 \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 6 \, E) \,, \\ -N \begin{pmatrix} c - O - R^{a5} \\ \parallel & 0 \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 7 \, E) \,, \qquad -N \begin{pmatrix} c - N - R^{a5} \\ \parallel & 0 \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 8 \, E) \,, \\ -N \begin{pmatrix} c - N - R^{a5} \\ \parallel & 1 \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 1 \, 1 \, E) \,, \qquad -N \begin{pmatrix} c - N - R^{a5} \\ \parallel & 1 \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 1 \, 0 \, E) \,, \\ -N \begin{pmatrix} c - N - R^{a5} \\ \parallel & 1 \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 1 \, 3 \, E) \,, \qquad -N \begin{pmatrix} c - N - R^{a5} \\ \parallel & 1 \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 1 \, 2 \, E) \,, \\ -N \begin{pmatrix} c - N - R^{a5} \\ \parallel & 1 \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 1 \, 3 \, E) \,, \qquad -N \begin{pmatrix} c - N - R^{a5} \\ \parallel & N - R^{a5} \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 1 \, 4 \, E) \,, \\ -N \begin{pmatrix} c - N - R^{a5} \\ \parallel & 1 \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 1 \, 5 \, E) \,, \qquad -N \begin{pmatrix} c - N - R^{a5} \\ \parallel & N - R^{a5} \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 1 \, 6 \, E) \,, \\ -N \begin{pmatrix} c - N - R^{a5} \\ \parallel & 1 \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 1 \, 7 \, E) \,, \qquad -N \begin{pmatrix} c - N - R^{a5} \\ \parallel & R^{b5} \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 1 \, 8 \, E) \,, \\ -N \begin{pmatrix} c - R^{a5} \\ \parallel & 1 \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 1 \, 9 \, E) \,, \qquad -N \begin{pmatrix} c - N - R^{a5} \\ \parallel & R^{b5} \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 1 \, 8 \, E) \,, \\ -N \begin{pmatrix} c - R^{a5} \\ \parallel & 1 \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 1 \, 9 \, E) \,, \qquad -N \begin{pmatrix} c - N - R^{a5} \\ \parallel & R^{a5} \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 1 \, 8 \, E) \,, \\ -N \begin{pmatrix} c - R^{a5} \\ \parallel & 1 \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 1 \, 9 \, E) \,, \qquad -N \begin{pmatrix} c - N - R^{a5} \\ \parallel & R^{a5} \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 1 \, 8 \, E) \,, \\ -N \begin{pmatrix} c - R^{a5} \\ \parallel & 1 \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 1 \, 9 \, E) \,, \qquad -N \begin{pmatrix} c - N - R^{a5} \\ \parallel & R^{a5} \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 1 \, 8 \, E) \,, \\ -N \begin{pmatrix} c - R^{a5} \\ \parallel & 1 \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 1 \, 9 \, E) \,, \qquad -N \begin{pmatrix} c - N - R^{a5} \\ \parallel & R^{a5} \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 1 \, 9 \, E) \,, \\ -N \begin{pmatrix} c - R^{a5} \\ \parallel & R^{a5} \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 1 \, 9 \, E) \,, \qquad -N \begin{pmatrix} c - N - R^{a5} \\ \parallel & R^{a5} \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 1 \, 9 \, E) \,, \\ -N \begin{pmatrix} c - N - R^{a5} \\ \parallel & R^{a5} \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 1 \, 1 \, E) \,, \qquad -N \begin{pmatrix} c - N - R^{a5} \\ \parallel & R^{a5} \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 1 \, 1 \, E) \,, \qquad -N \begin{pmatrix} c - N - R^{a5} \\ \parallel & R^{a5} \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 1 \, 1 \, E) \,, \qquad -N \begin{pmatrix} c - N - R^{a5} \\ \parallel & R^{a5} \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 1 \, 1 \, E) \,, \qquad -N \begin{pmatrix} c - N - R^{a5} \\ \parallel & R^{a5} \end{pmatrix}_{2} \quad (\omega - 1 \, 1 \, E) \,, \qquad$$

(式中、R<sup>a5</sup>及びR<sup>b5</sup>は、同一又は異なって、水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基、又は置換基を有していてもよいヘテロ環基を表すか、あるいは R<sup>a5</sup>及びR<sup>b5</sup>が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に、置換基を有していてもよい環状アミノ基を表す)で表される基があげられる

上記「ジ (アシル) -アミノ基」の定義において、

式  $(\omega-1E)$  で表される基で、 $R^{a5}$ が炭化水素基である基を「ビス(炭化水素

ーカルボニル) - アミノ基」、R \* 5 がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環ーカルボニル) - アミノ基」と称する。

式  $(\omega - 2E)$  で表される基で、 $R^{a5}$ が炭化水素基である基を「ビス(炭化水素 - オキシーカルボニル)- アミノ基」、 $R^{a5}$  がヘテロ環基である基を「ビス(ヘテロ環ーオキシーカルボニル)- アミノ基」と称する。

式  $(\omega - 3 E)$  で表される基で、 $R^{a5}$ が炭化水素基である基を「ビス(炭化水素 -カルボニルーカルボニル)-アミノ基」、 $R^{a5}$ がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環-カルボニルーカルボニル)-アミノ基」と称する。

式(ω-4E)で表される基で、R<sup>\*5</sup>が炭化水素基である基を「ビス(炭化水素 -オキシーカルボニルーカルボニル)-アミノ基」、R<sup>\*5</sup>がヘテロ環基である基 を「ビス(ヘテロ環-オキシーカルボニルーカルボニル)-アミノ基」と称する。

式  $(\omega - 5 E)$  で表される基で、 $R^{a5}$ が炭化水素基である基を「ビス(炭化水素 - スルファニルーカルボニル)- アミノ基」、 $R^{a5}$ がヘテロ環基である基を「ビス(ヘテロ環- スルファニルーカルボニル)- アミノ基」と称する。

式  $(\omega - 6E)$  で表される基で、 $R^{5}$  が炭化水素基である基を「ビス(炭化水素 - チオカルボニル)- アミノ基」、 $R^{5}$  がヘテロ環基である基を「ビス(ヘテロ 環- チオカルボニル)- アミノ基」と称する。

式 (ω-7E) で表される基で、R<sup>a5</sup>が炭化水素基である基を「ビス (炭化水素 -オキシーチオカルボニル) -アミノ基」、R<sup>a5</sup>がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環-オキシーチオカルボニル) -アミノ基」と称する。

式( $\omega$  - 8 E)で表される基で、 $R^{a5}$ が炭化水素基である基を「ビス(炭化水素 - スルファニルーチオカルボニル)- アミノ基」、 $R^{a5}$ がヘテロ環基である基を「ビス(ヘテロ環ースルファニルーチオカルボニル)- アミノ基」と称する。

式(ω-10E)で表される基で、R \* 5 及びR b 5 が炭化水素基である基を「ビス

[N, N-ジ (炭化水素) -カルバモイル] -アミノ基」、 $R^{a5}$ 及び $R^{b5}$ がヘテロ環基である基を「ビス [N, N-ジ (ヘテロ環) -カルバモイル] -アミノ基」、 $R^{a5}$ が炭化水素基であり $R^{b5}$ がヘテロ環基である基を「ビス (N-炭化水素-N -ヘテロ環ーカルバモイル) -アミノ基」、 $R^{a5}$ 及び $R^{b5}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「ビス (環状アミノーカルボニル) -アミノ基」と称する。

式( $\omega-1$ 1E)で表される基で、 $R^{a5}$ が炭化水素基である基を「ビス(N-炭化水素-チオカルバモイル)-アミノ基」、 $R^{a5}$ がヘテロ環基である基を「ビス (N-ヘテロ環-チオカルバモイル)-アミノ基」と称する。

式( $\omega-1$  2 E)で表される基で、 $R^{a5}$ 及び $R^{b5}$ が炭化水素基である基を「ビス  $[N, N-\bar{\nu}$ (炭化水素)-チオカルバモイル] -アミノ基」、 $R^{a5}$ 及び $R^{b5}$ が  $^{^{5}}$   $^{5}$   $^$ 

式( $\omega-1$  3 E)で表される基で、 $R^{a5}$ が炭化水素基である基を「ビス(N-炭化水素-スルファモイル)-アミノ基」、 $R^{a5}$ がヘテロ環基である基を「ビス(N-0トロ環-スルファモイル)-アミノ基」と称する。

式( $\omega-14E$ )で表される基で、 $R^{a5}$ 及び $R^{b5}$ が炭化水素基である基を「ビス [N, N-ジ(炭化水素)-スルファモイル] -アミノ基」、 $R^{a5}$ 及び $R^{b5}$ がヘテロ環基である基を「ビス [N, N-ジ(ヘテロ環)-スルファモイル] -アミノ基」、 $R^{a5}$ が炭化水素基であり  $R^{b5}$ がヘテロ環基である基を「ビス (N-炭化水素-N-ヘテロ環-スルファモイル)-アミノ基」、 $R^{a5}$ 及び $R^{b5}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「ビス(環状アミノースルホニル)-アミノ基」と称する。

式( $\omega-1$ 5E)で表される基で、R  $^{\circ}$ が炭化水素基である基を「ビス(N - 炭

化水素 - スルフィナモイル) - アミノ基」、R \* 5 がヘテロ環基である基を「ビス (N - ヘテロ環 - スルフィナモイル) - アミノ基」と称する。

式( $\omega-16E$ )で表される基で、 $R^{a5}$ 及び $R^{b5}$ が炭化水素基である基を「ビス [N, N-ジ(炭化水素)-スルフィナモイル] -アミノ基」、 $R^{a5}$ 及び $R^{b5}$ が ヘテロ環基である基を「ビス [N, N-ジ (ヘテロ環) -スルフィナモイル] -アミノ基」、 $R^{a5}$ が炭化水素基であり  $R^{b5}$ がヘテロ環基である基を「ビス (N-炭化水素-N-ヘテロ環-スルフィナモイル)-アミノ基」、 $R^{a5}$ 及び $R^{b5}$ が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「ビス (環状アミノースルフィニル) -アミノ基」と称する。

式  $(\omega - 1.7E)$  で表される基で、 $R^{45}$ が炭化水素基である基を「ビス(炭化水素ーオキシースルホニルー)アミノ基」、 $R^{45}$ がヘテロ環基である基を「ビス(ヘテロ環ーオキシースルホニル)-アミノ基」と称する。

式  $(\omega - 18E)$  で表される基で、 $R^{*5}$ が炭化水素基である基を「ビス(炭化水素ーオキシースルフィニル)ーアミノ基」、 $R^{*5}$ がヘテロ環基である基を「ビス(ヘテロ環ーオキシースルフィニル)ーアミノ基」と称する。

式( $\omega-19E$ )で表される基で、 $R^{*5}$ 及び $R^{*5}$ が炭化水素基である基を「ビス  $[O, O'-\bar{\nu}$ (炭化水素) -ホスホノ] -アミノ基」、 $R^{*5}$ 及び $R^{*5}$ がヘテロ 環基である基を「ビス  $[O, O'-\bar{\nu}$ (ヘテロ環) -ホスホノ] -アミノ基」、 $R^{*5}$ が炭化水素基であり $R^{*5}$ がヘテロ環基である基を「ビス(O-炭化水素-O' -ヘテロ環-ホスホノ) -アミノ基」と称する。

式  $(\omega - 20E)$  で表される基で、 $R^{*5}$ が炭化水素基である基を「ビス(炭化水素ースルホニル)ーアミノ基」、 $R^{*5}$ がヘテロ環基である基を「ビス(ヘテロ環ースルホニル)ーアミノ基」と称する。

式  $(\omega - 21E)$  で表される基で、 $R^{a5}$ が炭化水素基である基を「ビス(炭化水素 - スルフィニル) - アミノ基」、 $R^{a5}$ がヘテロ環基である基を「ビス(ヘテロ環ースルフィニル) - アミノ基」と称する。

上記式( $\omega-1E$ )乃至( $\omega-21E$ )で表される基における「炭化水素」とし

では、上記「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。例えば、式( $\omega-1$ E)で表される「ビス(炭化水素 -カルボニル) -アミノ基」としては、ビス(アルキルーカルボニル) -アミノ基、ビス(アルケニルーカルボニル) -アミノ基、ビス(アルキニルーカルボニル) -アミノ基、ビス(シクロアルキルーカルボニル) -アミノ基、ビス(シクロアルキルーカルボニル) -アミノ基、ビス(シクロアルケニルーカルボニル) -アミノ基、ビス(シクロアルケニルーカルボニル) -アミノ基、ビス(シクロアルキルーアルキルーカルボニル) -アミノ基等のビス(脂肪族炭化水素 -カルボニル) -アミノ基;ビス(アリールーカルボニル) -アミノ基;ビス(アラルキルーカルボニル) -アミノ基;ビス(架橋環式炭化水素 -カルボニル) -アミノ基;ビス(架橋環式炭化水素 -カルボニル) -アミノ基;ビス(アルペン系炭化水素 -カルボニル) -アミノ基が挙げられる。以下、式( $\omega-2$ E)乃至( $\omega-2$ 1E)で表される基も同様である。

上記式( $\omega-1$ E)乃至( $\omega-2$ 1E)で表される基における「ヘテロ環」としては、上記「ヘテロ環基」と同様の基が挙げられる。例えば、式( $\omega-1$ E)で表される「ビス(ヘテロ環ーカルボニル)-アミノ基」としては、例えば、ビス(単環式ヘテロアリールーカルボニル)-アミノ基、ビス(縮合多環式ヘテロアリールーカルボニル)-アミノ基、ビス(単環式非芳香族ヘテロ環ーカルボニル)アミノ基、ビス(縮合多環式非芳香族ヘテロ環ーカルボニル)アミノ基、ビス(縮合多環式非芳香族ヘテロ環ーカルボニル)-アミノ基が挙げられる。以下、式( $\omega-2$ E)乃至( $\omega-2$ 1E)で表される基も同様である。上記式( $\omega-1$ 0E)乃至( $\omega-1$ 6E)で表される基における「環状アミノ」としては、上記「環状アミノ基」と同様の基が挙げられる。

上記「アシルーアミノ基」及び「ジ(アシル)-アミノ基」を総称して、「アシル置換アミノ基」と称する。また、上記「N - 炭化水素-アミノ基」、「N + N +

以下、上記一般式 (I)、(I-1)、(I-2)、(I-3)、(I-4) で表される

化合物について具体的に説明する。

Xの定義における「主鎖の原子数が 2 ないし 5 である連結基」とは、環 Z と E の間に、主鎖の原子が 2 ないし 5 個連なっている連結基を意味する。上記「主鎖の原子数」は、ヘテロ原子の有無に関わらず、環 Z と E との間に存在する原子の数が最小となるように数えるものとする。例えば、 1 、 2 - - 2

上記「主鎖の原子数が 2 ないし 5 である連結基」は、下記 2 価基群  $\zeta-1$  より選択される基 1 個で形成されるか、或いは、下記 2 価基群  $\zeta-2$  より選択される基 1 ないし 4 種が 2 ないし 4 個結合して形成される。

## [2価基群ζ-1]下記式:

[2価基群ζ-2]下記式:

該 2 価基が 2 個以上結合する場合、各基は同一であっても異なっていてもよい。 上記「主鎖の原子数が 2 ないし 5 である連結基」としては、好適には、下記連結 基群  $\alpha$  より選択される基である。

[連結基群α]下記式:

(式中、左側の結合手が環 Z に結合し右側の結合手が E に結合する) 最も好適には、下記式:

(式中、左側の結合手が環 Z に結合し右側の結合手が E に結合する)で表される基である。

「主鎖の原子数が 2 ないし 5 である連結基」の定義における「該連結基は置換基を有していてもよい」の置換基としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられ、好適には、 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基であり、さらに好適には、メチル基である。該置換基は、環Z 又はE が有する置換基と一緒になって、それらが結合している原子と共に、置換基を有していてもよい環式基を形成してもよい。このような例としては、一般式(I)で表される化合物が、下記式:

$$\begin{array}{c} \mathsf{CF_3} \\ \mathsf{OH} \\ \mathsf{O} \\ \mathsf{Br} \end{array}$$

である化合物が挙げられる。

上記一般式(I)において、Aとしては、水素原子又はアセチル基を挙げることができ、好適には水素原子である。

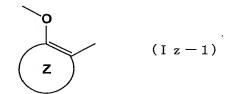
環Zの定義における「式-O-A (式中、Aは上記定義と同義である)及び式-X-E (式中、X及びEは上記定義と同義である)で表される基の他にさらに置換基を有していてもよいアレーン」の「アレーン」としては、単環式又は縮合多環式芳香族炭化水素が挙げられ、例えば、ベンゼン環、ナフタレン環、アンラセ

ン環、フェナントレン環、アセナフチレン環等が挙げられる。好適には、ベンゼン環、ナフタレン環等の $C_6 \sim C_{10}$ のアレーンであり、さらに好適には、ベンゼン環及びナフタレン環であり、最も好適には、ベンゼン環である。

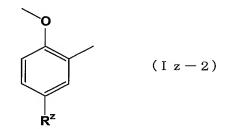
上記環Zの定義における「式-O-A(式中、Aは上記定義と同義である)及び式-X-E(式中、X及びEは上記定義と同義である)で表される基の他にさらに置換基を有していてもよいアレーン」の「置換基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。該置換基のアレーン上での置換位置は特に限定されない。また、該置換基が2個以上存在する場合、それらは同一であっても異なっていてもよい。

「置換基群 $\gamma-1$ z] ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、ヒドロキシ基、メトキシ基、メチル基、イソプロピル基、 t e r t - ブチル基、1, 1, 3, 3 - テトラメチルブチル基、2 - フェニルエテン <math>- 1 - 1

ル基、(トリメチルシリル) エチニル基、トリフルオロメチル基、ペンタフルオロ エチル基、フェニル基、4-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-フルオロ フェニル基、2、4ージフルオロフェニル基、2ーフェネチル基、1ーヒドロキ シエチル基、1-(メトキシイミノ)エチル基、1-[(ベンジルオキシ)イミノ] エチル基、2-チエニル基 [チオフェン-2-イル基]、3-チエニル基 [チオフ ェンー3-イル基]、1-ピロリル基[ピロール-1-イル基]、2-メチルチア ゾールー4-イル基、イミダゾ「1,2-a] ピリジン-2-イル基、2-ピリ ジル基〔ピリジン-2-イル基〕、アセチル基、イソブチリル基、ピペリジノカル ボニル基、4 -ベンジルピペリジノカルボニル基、(ピロール-1-イル) スルホ ニル基、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、N-[3,5-ビス(トリフル オロメチル)フェニル]カルバモイル基、N、N-ジメチルカルバモイル基、ス ルファモイル基、N-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]スルフ ァモイル基、N, Nージメチルスルファモイル基、アミノ基、N, Nージメチル アミノ基、アセチルアミノ基、ベンゾイルアミノ基、メタンスルホニルアミノ基、 ベンゼンスルホニルアミノ基、3-フェニルウレイド基、(3-フェニル)チオウ レイド基、(4-ニトロフェニル)ジアゼニル基、{「4-(ピリジン-2-イル) スルファモイル]フェニル}ジアゼニル基



が下記式 (Iz-2):



で表される場合の $R^z$ の位置に存在することが最も好ましい。このとき、該置換基を $R^z$ と定義することができる。 $R^z$ としては、好適には、下記「置換基群 $\gamma$  – 2z」から選択される基であり、更に好適には、ハロゲン原子及びtert – ブチル基であり、最も好適には、ハロゲン原子である。

[置換基群 y - 2 z] ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、メトキシ基、メチル 基、イソプロピル基、tertーブチル基、1、1、3、3ーテトラメチルブチ ル基、2-フェニルエテン-1-イル基、2,2-ジシアノエテン-1-イル基、 2-シアノ-2-(メトキシカルボニル)エテン-1-イル基、2-カルボキシ -2-シアノエテン-1-イル基、エチニル基、フェニルエチニル基、(トリメチ ルシリル)エチニル基、トリフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基、フェ ニル基、4-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-フルオロフェニル基、2、 4-ジフルオロフェニル基、2-フェネチル基、1-ヒドロキシエチル基、1-(メトキシイミノ) エチル基、1-[(ベンジルオキシ) イミノ] エチル基、2-チエニル基、3ーチエニル基、1ーピロリル基、2ーメチルチアゾールー4ーイ ル基、イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-2-イル基、2-ピリジル基、アセチ ル基、イソブチリル基、ピペリジノカルボニル基、4-ベンジルピペリジノカル ボニル基、(ピロールー1ーイル) スルホニル基、カルボキシ基、メトキシカルボ ニル基、N-[3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]カルバモイル基、 N, N-ジメチルカルバモイル基、スルファモイル基、N-「3,5-ビス(ト リフルオロメチル)フェニル]スルファモイル基、N, N-ジメチルスルファモ イル基、アミノ基、N、Nージメチルアミノ基、アセチルアミノ基、ベンゾイル アミノ基、メタンスルホニルアミノ基、ベンゼンスルホニルアミノ基、3-フェ

ニルウレイド基、(3-フェニル) チオウレイド基、(4-ニトロフェニル) ジアゼニル基、{[4-(ピリジン-2-イル) スルファモイル] フェニル} ジアゼニル基

上記環 Z の定義における「式 – O – A(式中、A は上記定義と同義である)及び式 – X – E(式中、X 及び E は上記定義と同義である)で表される基の他に更に置換基を有していてもよいアレーン」が「式 – O – A(式中、A は上記定義と同義である)及び式 – X – E(式中、X 及び E は上記定義と同義である)で表される基の他に更に置換基を有していてもよいナフタレン環」である場合、好適には、ナフタレン環である。

環Zの定義における「式-O-A(式中、Aは上記定義と同義である)及び式-X-E (式中、X及びEは上記定義と同義である)で表される基の他にさらに置 換基を有していてもよいヘテロアレーン」の「ヘテロアレーン」としては、環系 を構成する原子(環原子)として、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子等から選択 されたヘテロ原子1ないし3種を少なくとも1個含む単環式又は縮合多環式芳香 族複素環が挙げられ、例えば、フラン環、チオフェン環、ピロール環、オキサゾ ール環、イソオキサゾール環、チアゾール環、イソチアゾール環、イミダゾール 環、ピラゾール環、1,2,3ーオキサジアゾール環、1,2,3ーチアジアゾ ール環、1,2,3-トリアゾール環、ピリジン環、ピリダジン環、ピリミジン 環、ピラジン環、1,2,3ートリアジン環、1,2,4ートリアジン環、1H -アゼピン環、1,4-オキセピン環、1,4-チアゼピン環、ベンゾフラン環、 イソベンゾフラン環、ベンゾ〔b〕チオフェン環、ベンゾ〔c〕チオフェン環、 インドール環、2H-イソインドール環、1H-インダゾール環、2H-インダ ゾール環、ベンゾオキサゾール環、1,2-ベンゾイソオキサゾール環、2,1 ーベンゾイソオキサゾール環、ベンゾチアゾール環、1,2ーベンゾイソチアゾ ール環、2,1-ベンゾイソチアゾール環、1,2,3-ベンゾオキサジアゾー ル環、2,1,3-ベンゾオキサジアゾール環、1,2,3-ベンゾチアジアゾ ール環、2,1,3-ベンゾチアジアゾール環、1H-ベンゾトリアゾール環、

2Hーベンゾトリアゾール環、キノリン環、イソキノリン環、シンノリン環、キナゾリン環、キノキサリン環、フタラジン環、ナフチリジン環、1H-1, 5-ベンゾジアゼピン環、カルバゾール環、 $\alpha$ -カルボリン環、 $\beta$ -カルボリン環、 $\gamma$ -カルボリン環、アクリジン環、フェノキサジン環、フェノチアジン環、フェナジン環、フェナントリジン環、フェナントロリン環、チアントレン環、インドリジン環、フェノキサチイン環等の5ないし14員の単環式又は縮合多環式芳香族複素環が挙げられる。好適には、5ないし13員の単環式又は縮合多環式芳香族複素環であり、さらに好適には、チオフェン環、ピリジン環、インドール環、キノキサリン環、及びカルバゾール環である。

上記環 Z の定義における「式 – O – A (式中、A は上記定義と同義である)及び式 – X – E (式中、X 及び E は上記定義と同義である)で表される基の他にさらに置換基を有していてもよいヘテロアレーン」の「置換基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。該置換基のヘテロアレーン上での置換位置は特に限定されない。また、該置換基が 2 個以上存在する場合、それらは同一であっても異なっていてもよい。

上記環 Z の定義における「式 – O – A (式中、A は上記定義と同義である)及び式 – X – E (式中、X 及び E は上記定義と同義である)で表される基の他にさらに置換基を有していてもよいヘテロアレーン」の「置換基」としては、好適には、ハロゲン原子である。

Eの定義における「置換基を有していてもよいアリール基」の「アリール基」としては、上記「炭化水素基」の定義における「アリール基」と同様の基が挙げられ、好適には、フェニル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基等の $C_6\sim C_{10}$ のアリール基であり、最も好適には、フェニル基である。

上記Eの定義における「置換基を有していてもよいアリール基」の「置換基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。該置換基のアリール基上での置換位置は特に限定されず、該置換基が2個以上存在する場合、それらは同一であっても異なっていてもよい。

上記Eの定義における「置換基を有していてもよいアリール基」が「置換基を有していてもよいフェニル基」である場合、好適には、「モノ置換フェニル基」、「ジ 置換フェニル基」、及び「3個以上の置換基を有するフェニル基」であり、更に好 適には、「ジ置換フェニル基」である。

上記Eの定義における「置換基を有していてもよいアリール基」が「ジ置換フェニル基」である場合、好適な基の具体例としては、下記「置換基群 $\delta-1$ e」に示す基が挙げられる。

[置換基群  $\delta-1$ e] 3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基、3, 4 -プロピレンジオキシフェニル基、3,5-ジクロロフェニル基、2,4-ジヒ ドロキシフェニル基、2,5-ジメトキシフェニル基、2-クロロー5-(トリ フルオロメチル)フェニル基、3,5-ビス[(1,1-ジメチル)エチル]フェ ニル基、2,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基、4-クロロー2-(ト リフルオロメチル)フェニル基、2-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)フ ェニル基、4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-クロロ -3- (トリフルオロメチル)フェニル基、3-フルオロ-5- (トリフルオロ メチル)フェニル基、3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2 -フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-ニトロ-3-(トリ フルオロメチル)フェニル基、2-ニトロ-5-(トリフルオロメチル)フェニ ル基、4-シアノ-3-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-メチル-3-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-メチル-3-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-メチル-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-メトキ シー3-(トリフルオロメチル)フェニル基、3-メトキシー5-(トリフルオ ロメチル) フェニル基、2-メトキシ-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、 2-メチルスルファニル-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-(1-ピロリジニル) -5- (トリフルオロメチル) フェニル基、2-モルホリノ-5 - (トリフルオロメチル)フェニル基、2-クロロ-4-(トリフルオロメチル) フェニル基、2,5-ジクロロフェニル基、3,4-ジクロロフェニル基、3,

5-ジフルオロフェニル基、3,5-ジニトロフェニル基、2,5-ビス[(1, 1-ジメチル) エチル] フェニル基、5-[(1,1-ジメチル) エチル] -2-メトキシフェニル基、3,5-ジメチルフェニル基、4-メトキシビフェニルー 3-イル基、3、5-ジメトキシフェニル基、3、5-ビス(メトキシカルボニ ル)フェニル基、2-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、3-メ トキシカルボニルー5-(トリフルオロメチル)フェニル基、3-カルボキシー 5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-(2-ナフチルオキシ)-5-(ト リフルオロメチル)フェニル基、2-(2,4-ジクロロフェノキシ)-5-(ト リフルオロメチル)フェニル基、2-[4-(トリフルオロメチル)ピペリジン -1-イル]-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-(2,2,2-ト リフルオロエトキシ)-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-(2-メ トキシフェノキシ) -5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-(4-クロ ロ-3,5-ジメチルフェノキシ)-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、 2-ピペリジノ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-(4-メチルフ ェノキシ) -5- (トリフルオロメチル) フェニル基、2- (4-クロロフェノ キシ) -5- (トリフルオロメチル) フェニル基、3,5-ジカルボキシフェニ ル基、5-イソプロピル-2-メチルフェニル基、2,5-ジエトキシフェニル 基、2、5-ジメチルフェニル基、5-クロロー2-シアノ基、5-ジエチルス ルファモイルー2ーメトキシフェニル基、2ークロロー5ーニトロフェニル基、 2-メトキシ-5-(フェニルカルバモイル)フェニル基、5-アセチルアミノ -2-メトキシフェニル基、5-メトキシ-2-メチルフェニル基、2,5-ジ ブトキシフェニル基、2,5-ジイソペンチルオキシ基、5-カルバモイル-2 -メトキシフェニル基、5-[(1,1-ジメチル)プロピル]-2-フェノキシ フェニル基、2-ヘキシルオキシ-5-メタンスルホニル基、5-(2,2-ジ メチルプロピオニル) -2-メチルフェニル基、5-メトキシ-2-(1-ピロ リル)フェニル基、5-クロロ-2-(p-トルエンスルホニル)フェニル基、 2-クロロ-5- (p-トルエンスルホニル)フェニル基、2-フルオロ-5-

メタンスルホニル基、2ーメトキシー5ーフェノキシ基、4ーメチルビフェニル -3-イル基、2-メトキシ-5-(1-メチル-1-フェニルエチル)フェニ ル基、5-モルホリノー2-ニトロフェニル基、5-フルオロー2-(1-イミ ダゾリル)フェニル基、2-ブチル-5-ニトロフェニル基、5-[(1,1-ジ メチル)] プロピルー2ーヒドロキシフェニル基、2ーメトキシー5ーメチルフェ ニル基、2,5-ジフルオロフェニル基、4-イソプロピル-2-(トリフルオ ロメチル)フェニル基、2-ニトロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル基、 4-ブロモー3-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-ブロモー2-(トリ フルオロメチル)フェニル基、2-ブロモ-4-(トリフルオロメチル)フェニ ル基、4-フルオロ-2-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-イソプロポ キシー2-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-シアノ-2-(トリフルオ ロメチル)フェニル基、2,6-ジイソプロピルフェニル基、2,6-ジメチル フェニル基、3,4-ジメチルフェニル基、2,4-ジクロロフェニル基、2, 3-ジメチルフェニル基、インダン-5-イル基、2,4-ジメチルフェニル基、 2, 6-ジクロロフェニル基、4-ブロモ-2-(トリフルオロメトキシ)フェ ニル基、3,4-エチレンジオキシフェニル基、3-クロロ-4-シアノフェニ ル基、3-クロロー4-(トリフルオロメトキシ)フェニル基、2-クロロー4 ーシアノフェニル基、2、3ージクロロフェニル基、4ーイソプロピルー3ーメ チルフェニル基、4-[(1,1-ジメチル)プロピル]-2-ヒドロキシフェニ ル基、3-クロロー2-シアノフェニル基、2-シアノー4-メチルフェニル基、 2, 2-ジフルオロー1, 3-ベンゾジオキソールー4-イル基、2, 2, 3, 3-テトラフルオロー1、4-ベンゾジオキセン-5-イル基、3-クロロ-4 - (トリフルオロメチルスルファニル)フェニル基、2-ニトロ-4-(トリフ ルオロメトキシ)フェニル基、2,2-ジフルオロ-1,3-ベンゾジオキソー ルー5-イル基、2-メチルー4-(トリフルオロメトキシ)フェニル基、4-ブロモー2-フルオロフェニル基、2,4-ビス(メタンスルホニル)フェニル 基、2,2,3,3ーテトラフルオロー1,4ーベンゾジオキセンー6ーイル基、

2ーベンゾイルー4ークロロフェニル基、2ーブロモー4ーフルオロフェニル基、3,4ージメトキシフェニル基、3,4ージフルオロフェニル基、3ークロロー4ーメトキシフェニル基、2ークロロー4ーニトロフェニル基、2,4ージフルオロフェニル基、2ーベンゾイルー5ーメチルフェニル基、2ーブロモー4ー(トリフルオロメトキシ)フェニル基、3,4ージへキシルオキシフェニル基、2,4ービス(トリフルオロメチル)フェニル基、4ーシアノー2ー(トリフルオロメトキシ)フェニル基、2ー(4ーシアノフェノキシ)ー5ー(トリフルオロメチル)フェニル基、2ー(4ーメトキシフェノキシ)ー5ー(トリフルオロメチル)フェニル基、2ー(4ーメトキシフェノキシ)ー5ー(トリフルオロメチル)フェニル基

上記Eの定義における「置換基を有していてもよいアリール基」が「ジ置換フェニル基」である場合、更に好適には、「2,5-ジ置換フェニル基」及び「3,5-ジ置換フェニル基」である。

上記Eの定義における「置換基を有していてもよいアリール基」が「2, 5 - ジ 置換フェニル基」である場合、好適な基の具体例としては、下記「置換基群  $\delta$  - 2 e 」に示す基が挙げられる。

ルオロメチル)フェニル基、2-[4-(トリフルオロメチル)ピペリジン-1 ーイル] -5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-(2,2,2-トリフ ルオロエトキシ) -5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-(2-メトキ シフェノキシ) -5- (トリフルオロメチル) フェニル基、2- (4-クロロー 3, 5-ジメチルフェノキシ)-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-ピペリジノ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-(4-メチルフェノ キシ)-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-(4-クロロフェノキシ) -5-(トリフルオロメチル)フェニル基、5-イソプロピル-2-メチルフェ ニル基、2,5ージエトキシフェニル基、2,5ージメチルフェニル基、5ーク ロロー2-シアノ基、5-ジエチルスルファモイルー2-メトキシフェニル基、 2-クロロ-5-ニトロフェニル基、2-メトキシ-5-(フェニルカルバモイ ル)フェニル基、5-アセチルアミノ-2-メトキシフェニル基、5-メトキシ -2-メチルフェニル基、2,5-ジブトキシフェニル基、2,5-ジイソペン チルオキシ基、5-カルバモイル-2-メトキシフェニル基、5-[(1,1-ジ メチル)プロピル]-2-フェノキシフェニル基、2-ヘキシルオキシ-5-メ タンスルホニル基、5-(2,2-ジメチルプロピオニル)-2-メチルフェニ ル基、5-メトキシー2-(1-ピロリル)フェニル基、5-クロロ-2-(p ートルエンスルホニル)フェニル基、2-クロロ-5-(p-トルエンスルホニ ル)フェニル基、2-フルオロ-5-メタンスルホニル基、2-メトキシ-5-フェノキシ基、2-メトキシ-5-(1-メチル-1-フェニルエチル)フェニ ル基、5-モルホリノ-2-ニトロフェニル基、5-フルオロ-2-(1-イミ ダゾリル)フェニル基、2-ブチル-5-ニトロフェニル基、5-[(1,1-ジ メチル)プロピル]-2-ヒドロキシフェニル基、2-メトキシ-5-メチルフ エニル基、2,5-ジフルオロフェニル基、2-ベンゾイル-5-メチルフェニ ル基、2-(4-シアノフェノキシ)-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、 2- (4-メトキシフェノキシ) -5- (トリフルオロメチル) フェニル基 上記Eの定義における「置換基を有していてもよいアリール基」が「2,5-ジ

置換フェニル基」である場合、更に好適には、「2,5-ジ置換フェニル基(但し、該置換基の少なくとも1個はトリフルオロメチル基である)」であり、特に更に好適には、下記「置換基群 $\delta-3$ e」から選択される基であり、最も好適には、2,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基である。

[置換基群  $\delta - 3e$ ] 2-クロロ-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基、2-フルオロ-5-(トリフルオ ロメチル)フェニル基、2-ニトロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、 2-メチル-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-メトキシ-5-(ト リフルオロメチル)フェニル基、2-メチルスルファニル-5-(トリフルオロ メチル)フェニル基、2-(1-ピロリジニル)-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-モルホリノ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-ブ ロモー5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-(2-ナフチルオキシ)-5- (トリフルオロメチル) フェニル基、2- (2, 4-ジクロロフェノキシ) -5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-[4-(トリフルオロメチル) ピペリジン-1-イル]-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2 - (2-メトキシフェノキシ) -5- (トリフルオロメチル) フェニル基、2-(4-クロロー3, 5-ジメチルフェノキシ) -5- (トリフルオロメチル) フ エニル基、2-ピペリジノ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-(4 -メチルフェノキシ) -5- (トリフルオロメチル) フェニル基、2- (4-ク ロロフェノキシ) -5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-(4-シアノ フェノキシ) - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル基、2 - (4 - メトキシフ エノキシ) -5-(トリフルオロメチル) フェニル基

上記Eの定義における「置換基を有していてもよいアリール基」が「3,5-ジ 置換フェニル基」である場合、好適な基の具体例としては、下記「置換基群 $\delta$  -4 e」に示す基が挙げられる。

[置換基群  $\delta - 4 e$ ] 3,  $5 - \forall \lambda$  (トリフルオロメチル) フェニル基、3, 5

ージクロロフェニル基、3,5ービス[(1,1ージメチル) エチル]フェニル基、3ーフルオロー5ー(トリフルオロメチル)フェニル基、3ーブロモー5ー(トリフルオロメチル)フェニル基、3ーメトキシー5ー(トリフルオロメチル)フェニル基、3,5ージフルオロフェニル基、3,5ージニトロフェニル基、3,5ージメチルフェニル基、3,5ージメトキシフェニル基、3,5ービス(メトキシカルボニル)フェニル基、3ーメトキシカルボニルー5ー(トリフルオロメチル)フェニル基、3ーカルボキシー5ー(トリフルオロメチル)フェニル基、3ーガルボキシフェニル基、3,5ージカルボキシフェニル基、3,5ージカルボキシフェニル基、3,5ージカルボキシフェニル基

上記「置換基を有していてもよいアリール基」が「3,5ージ置換フェニル基」である場合、更に好適には、「3,5ージ置換フェニル基(但し、該置換基の少なくとも1個はトリフルオロメチル基である)」であり、特に更に好適には、下記「置換基群 $\delta-5$ e」から選択される基であり、最も好適には、3,5ービス(トリフルオロメチル)フェニル基である。

「置換基群  $\delta-5$ e ] 3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル基、3-フルオロ-5- (トリフルオロメチル) フェニル基、3-ブロモ-5- (トリフルオロメチル) フェニル基、3-メトキシ-5- (トリフルオロメチル) フェニル基、3-メトキシカルボニル-5- (トリフルオロメチル) フェニル基、3-メトキシカルボニル-5- (トリフルオロメチル) フェニル基

上記Eの定義における「置換基を有していてもよいアリール基」が「モノ置換フェニル基」である場合、好適な基の具体例としては、下記「置換基群 $\delta-6$ e」に示す基が挙げられる。

「置換基群 δ - 6 e ] 4 - メトキシフェニル基、4 - クロロフェニル基、2 - メトキシフェニル基、2 - (トリフルオロメチル)フェニル基、3 - (トリフルオロメチル)フェニル基、3 - クロロフェニル基、4 - (トリフルオロメチル)フェニル基、3 - クロロフェニル基、ビフェニルー3 - イル基、3 - アセチルフェニル基、3 - (アセチルアミノ)フェニル基、3 - カルバモイルフェニル基、3 - メチルカルバモイルフェニル基、4 - メチルフェニル基、3 - (トリフルオロメトキシ)フェニル基、

2-ベンジルフェニル基、4-(トリフルオロメトキシ)フェニル基、4-[(1, 1-ジメチル) エチル] フェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソ プロポキシフェニル基、4-ヘキシルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-シクロヘキシルフェニル基、4-ベンジルフェニル基、2-クロロフェニル基、 2-メチルフェニル基、4-ブチルフェニル基、4-ベンジルオキシフェニル基、 3-ベンジルフェニル基、4-ヘキシルオキシフェニル基、3-イソプロピルフ エニル基、4-シアノフェニル基、3-シアノフェニル基、4-(エトキシカル ボニルメチル)フェニル基、3-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル 基、4-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル基、4-(トリフルオロ メタンスルホニル)フェニル基、3-エチニルフェニル基、4-(1-メチルプ ロピル)フェニル基、3ーベンゾイルフェニル基、3ーメトキシフェニル基、4 - (アセチルアミノ) フェニル基、4-スルファモイルフェニル基、4-(ジフ ルオロメトキシ)フェニル基、3-メチルスルファニルフェニル基、4-メタン スルホニルフェニル基、3-(ブチルスルファモイル)フェニル基、3-ベンジ ルオキシフェニル基、4-(p-トルエンスルホニルアミノ)フェニル基、4-モルホリノフェニル基、3-[(1,1-ジメチル)エチル]フェニル基、3-(5 -メチルフラン一2-イル)フェニル基、3-スルファモイルフェニル基、3-(トリフルオロメタンスルホニル)フェニル基、3-ヘキシルオキシフェニル基、 4-アセチルフェニル基、ビフェニル-2-イル基、ビフェニル-4-イル基、 3- [5-フェニル-3-(トリフルオロメチル)ピラゾール-1-イル]フェ ニル基、 $3-{5-[(1,1-ジメチル) エチル]-3-(トリフルオロメチル)}$ ピラゾール-1-イル}フェニル基、4-[3,5-ビス(トリフルオロメチル) ピラゾールー1ーイル]フェニル基、3-[3,5-ビス(トリフルオロメチル) ピラゾールー1ーイル]フェニル基、4-[5-フェニルー3-(トリフルオロ メチル) ピラゾールー1ーイル] フェニル基

上記Eの定義における「置換基を有していてもよいアリール基」が「3個以上の 置換基を有するフェニル基」である場合、好適な基の具体例としては、下記「置

換基群  $\delta - 7$  e」に示す基が挙げられる。

[置換基群 δ - 7 e] 3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) - 2 - ブロモフェニル基、3, 4, 5 - トリクロロフェニル基、3, 5 - ジクロロー4 - ヒドロキシフェニル基、3, 4, 5 - トリクロロフェニル基、3, 5 - ジクロロー4 - ヒドロキシフェニル基、ペンタフルオロフェニル基、3, 5, 5, 8, 8 - ペンタメチルー5, 6, 7, 8 - テトラヒドロナフタレン - 2 - イル基、3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) - 2 - メチルフェニル基、2, 6 - ジクロロー4 - (トリフルオロメチル) フェニル基、2, 4 - ジメトキシー5 - (トリフルオロメチル) フェニル基、4 - クロロー2 - (4 - クロロベンゼンスルホニル) - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル基、2, 3 - ジフルオロー4 - (トリフルオロメチル) フェニル基、2, 3 - ジフルオロー4 - (トリフルオロメチル) フェニル基、2, 3, 5, 6 - テトラフルオロー4 - (トリフルオロメチル) フェニル基、2, 4, 6 - トリメチルフェニル基、2 - シアノー4, 5 - ジメトキシフェニル基、2, 4 - ジクロロー5 - イソプロポキシフェニル基、2, 3, 5 - トリフルオロフェニル基、2, 4, 5 - トリクロロフェニル基、5 - エトキシー4 - フルオロー2 - ニトロフェニル基

上記Eの定義における「置換基を有していてもよいアリール基」が「置換基を有していてもよいナフチル基」である場合、好適な基の具体例としては、1ーナフチル基、4ーメトキシナフタレン-2ーイル基、及び4ーヒドロキシ-3ーメチルナフタレン-1ーイル基が挙げられる。

Eの定義における「置換基を有していてもよいへテロアリール基」の「ヘテロアリール基」としては、上記「ヘテロ環基」の定義における「単環式ヘテロアリール基」及び「縮合多環式ヘテロアリール基」と同様の基が挙げられる。好適には、5ないし13員のヘテロアリール基であり、このとき、好適な基の具体例としては、チエニル基、ピラゾリル基、オキサゾリル基、1,3,4ーチアジアゾリル基、ピリジル基、ピリミジニル基、インドリル基、キノリル基、カルバゾリル基、チアゾリル基、及びピラジニル基が挙げられる。

Eの定義における「置換基を有していてもよいへテロアリール基」の「ヘテロアリール基」としては、更に好適には、5員のヘテロアリール基であり、特に更に好適には、チエニル基、ピラゾリル基、オキサゾリル基、1,3,4ーチアジアゾリル基、及びチアゾリル基であり、最も好適には、チアゾリル基である。

上記Eの定義における「置換基を有していてもよいへテロアリール基」の「置換基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。該置換基のヘテロアリール基上での置換位置は特に限定されず、該置換基が2個以上存在する場合、それらは同一であっても異なっていてもよい。

上記Eの定義における「置換基を有していてもよいヘテロアリール基」が「置換基を有していてもよいチアゾリル基」である場合、好適には、「置換基を有していてもよいチアゾールー2ーイル基」であり、更に好適には、「モノ置換チアゾールー2ーイル基」、及び「ジ置換チアゾールー2ーイル基」であり、特に更に好適には、「ジ置換チアゾールー2ーイル基」である。

上記Eの定義における「置換基を有していてもよいへテロアリール基」が「ジ置換チアゾールー2ーイル基」である場合、好適には、下記「置換基群 $\delta-8$ e」から選択される基であり、最も好適には、4-[(1,1-ジメチル) エチル] -5-[(2,2-ジメチル) プロピオニル] チアゾールー2ーイル基である。

[置換基群  $\delta - 8$  e ]  $5 - 7 \pi \pi - 4 - [(1, 1 - 3 y + 2 w)]$  エチル] チアゾールー2ーイル基、 $5 - 7 \pi \pi - 4 - (y \pi - 2 w)$  エチル) チアゾールー2ーイル基、 $5 - 3 \pi - 4 - [(1, 1 - 3 y + 2 w)]$  エチル] チアゾールー2ーイル基、 $5 - 3 \pi - 4 - 2 \pi - 4 w$  表、 $5 - 3 \pi - 4 \pi - 2 \pi - 4 w$  表、 $5 - 3 \pi - 4 \pi - 2 \pi - 4 w$  表、 $5 - 3 \pi - 4 \pi - 2 \pi - 4 w$  表、 $5 - 3 \pi - 4 \pi - 2 \pi - 4 u$  表、 $5 - 3 \pi - 4 \pi - 2 \pi - 4 u$  表、 $5 - 3 \pi - 4 \pi - 2 \pi - 4 u$  表、 $5 - 3 \pi - 4 \pi - 2 \pi - 4 u$  表、 $4 - 3 \pi - 4 \pi - 2 \pi - 4 u$  表、 $4 - 3 \pi - 4 \pi - 4 u$  子ル) フェニル] チアゾールー2ーイル基、 $4 - 4 \pi - 4 u$  表、 $4 - 4 \pi - 4 u$  是、 $4 - 4 \pi - 4 u$  是、4 - 4 u 是、4 - 4 u

4-ブチル-5-フェニルチアゾール-2-イル基、4-[(1,1-ジメチル) エチル] -5-[(2, 2-ジメチル) プロピオニル] チアゾール-2-イル基、 4-[(1, 1-ジメチル) エチル] -5-(エトキシカルボニル) チアゾールー2-イル基、4-[(1,1-ジメチル) エチル] - 5-ピペリジノチアゾールー2-イル基、4- [(1, 1-ジメチル) エチル] - 5-モルホリノチアゾールー 2-イル基、4- [(1, 1-ジメチル) エチル] - 5- (4-メチルピペラジン - (4-フェニルピペラジン-1-イル)チアゾール-2-イル基、5-カルボ キシメチルー4-フェニルチアゾールー2-イル基、4,5-ジフェニルチアゾ ールー2-イル基、4-ベンジルー5-フェニルチアゾールー2-イル基、5-フェニル-4-(トリフルオロメチル)チアゾール-2-イル基、5-アセチル -4-フェニルチアゾール-2-イル基、5-ベンゾイル-4-フェニルチアゾ ールー2-イル基、5-エトキシカルボニルー4-フェニルチアゾールー2-イ ル基、5-エトキシカルボニル-4-(ペンタフルオロフェニル)チアゾール-2-イル基、5-メチルカルバモイル-4-フェニルチアゾール-2-イル基、 5-エチルカルバモイル-4-フェニルチアゾール-2-イル基、5-イソプロ ピルカルバモイルー4-フェニルチアゾールー2-イル基、5-(2-フェニル エチル) カルバモイルー4-フェニルチアゾールー2-イル基、5-エトキシカ ルボニル-4-(トリフルオロメチル)チアゾール-2-イル基、5-カルボキ シカルボニル)メチルー4-フェニルチアゾールー2-イル基、5-カルボキシ - 4 - フェニルチアゾール - 2 - イル基、 5 - プロピルカルバモイル - 4 - フェ ニルチアゾールー2ーイル基

上記Eの定義における「置換基を有していてもよいヘテロアリール基」が「モノ置換チアゾールー 2 ーイル基」である場合、好適な基の具体例としては、下記「置換基群  $\delta$  - 9 e 」に示す基が挙げられる。

[置換基群  $\delta - 9$  e] 4 - [(1, 1 - ジメチル) エチル] チアゾールー <math>2 - 4ル

基、4-7ェニルチアゾールー2ーイル基、4-[3,5-ビス(トリフルオロメチル) フェニル] チアゾールー2ーイル基、4-(2,4-𝗓)クロロフェニル) チアゾールー2ーイル基、4-(3,4-𝗓)クロロフェニル) チアゾールー2ーイル基、4-[4-(トリフルオロメチル) フェニル] チアゾールー<math>2ーイル基、 $4-(2,5-\~]$ フルオロフェニル) チアゾールー2ーイル基、 $4-(4-\gimel)$ トキシフェニル) チアゾールー2ーイル基、4-[3-(トリフルオロメチル) フェニル] チアゾールー<math>2ーイル基、4-[3-(トリフルオロメチル) フェニル] チアゾールー<math>2ーイル基、 $4-(^{\circ})$ クフルオロフェニル) チアゾールー2ーイル基

以下、上記一般式 (I-1)で表される化合物について具体的に説明する。 Z¹の定義における「5位に置換基を有していてもよい2-ヒドロキシフェニル 基」、及び「5位に置換基を有していてもよい2-アセトキシフェニル基」の「置換基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。

上記 $Z^1$ の定義における「5位に置換基を有していてもよい2-ヒドロキシフェニル基」としては、好適には、「5位に置換基を有する2-ヒドロキシフェニル基」である。

[置換基群 $\gamma^1-1$  z ] ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、メトキシ基、メチル基、イソプロピル基、t e r t - ブチル基、1 , 1 , 3 , 3 - テトラメチルブチル基、2 - フェニルエテン -1 - イル基、2 , 2 - ジシアノエテン -1 - イル基、2 - シアノー2 - (メトキシカルボニル) エテン -1 - イル基、2 - カルボキシ -2 - シアノエテン -1 - イル基、エチニル基、フェニルエチニル基、(トリメチルシリル) エチニル基、トリフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基、

フェニル基、4 - (トリフルオロメチル) フェニル基、4 - フルオロフェニル基、2、4 - ジフルオロフェニル基、2 - フェネチル基、1 - ヒドロキシエチル基、1 - ヒドロキシエチル基、1 - (メトキシイミノ) エチル基、1 - [(ベンジルオキシ) イミノ] エチル基、2 - チエニル基、3 - チエニル基、1 - ピロリル基、2 - メチルチアゾールー4 - イル基、イミダゾ [1、2 - a] ピリジン-2 - イル基、2 - ピリジル基、アセチル基、イソブチリル基、ピペリジノカルボニル基、4 - ベンジルピペリジノカルボニル基、(ピロールー1 - イル) スルホニル基、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、N - [3、5 - ビス(トリフルオロメチル) フェニル] カルバモイル基、N - [3、5 - ビス(トリフルオロメチル) フェニル] スルファモイル基、N - [3、5 - ビス(トリフルオロメチル) フェニル] スルファモイル基、N - ジメチルスルファモイル基、アミノ基、N N - ジメチルアミノ基、ベンゾイルアミノ基、メタンスルホニルアミノ基、ベンゼンスルホニルアミノ基、3 - フェニルウレイド基、(3 - フェニル) チオウレイド基、(4 - ニトロフェニル)ジアゼニル基、{[4 - (ピリジン-2 - イル) スルファモイル] フェニル}ジアゼニル基

上記 Z¹の定義における「5位に置換基を有していてもよい2-アセトキシキシフェニル基」としては、好適には、「5位に置換基を有する2-アセトキシフェニル基」である。

上記 Z¹の定義における「5位に置換基を有していてもよい2-アセトキシフェニル基」及び「5位に置換基を有する2-アセトキシフェニル基」の「置換基」としては、好適には、ハロゲン原子である。

E¹の定義における「置換されていても良いフェニル基」の「置換されていてもよい」は「置換基を有していてもよい」と同義である。

上記 E¹の定義における「置換されていても良いフェニル基」の「置換基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。該置換基のフェニル基上での置換位置は特に限定されない。また、該置換基が 2 個以上存在する場合、それらは同一であっても異なっていてもよい。

上記 $E^1$ の定義における「置換されていても良いフェニル基」としては、好適には、3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基、2,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基、3個以上の置換基を有するフェニル基(該置換基のうち少なくとも1個はトリフルオロメチル基である)、ジ置換フェニル基(該置換基のうち少なくとも1個はトリフルオロメチル基である。但し、該ジ置換フェニル基として2,5-ジ置換フェニル基及び3,5-ジ置換フェニル基は除く)であり、更に好適には、3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基、及び2,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基である。

上記 $E^1$ の定義における「置換されていても良いフェニル基」が「3 個以上の置換基を有するフェニル基(該置換基のうち少なくとも1 個はトリフルオロメチル基である)」である場合、好適な基の具体例としては、下記「置換基群  $\delta^1-1$  e」に示す基が挙げられる。

上記 $E^1$ の定義における「置換されていても良いフェニル基」が「ジ置換フェニル基(該置換基のうち少なくとも1 個はトリフルオロメチル基である。但し、該ジ置換フェニル基として、2, 5 - ジ置換フェニル基及び3, 5 - ジ置換フェニル基は除く)」である場合、好適な基の具体例としては、下記「置換基群  $\delta^1$  - 2 e」に示す基が挙げられる。

[置換基群 $\delta^1$ -2e] 4-クロロ-2-(トリフルオロメチル)フェニル基、

2-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-クロロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル基、4ーシアノ-3ー(トリフルオロメチル)フェニル基、4ーシアノ-3ー(トリフルオロメチル)フェニル基、4ーメチル)フェニル基、4ーメチル)フェニル基、4ーメトキシー3-(トリフルオロメチル)フェニル基、4ーメトキシー3-(トリフルオロメチル)フェニル基、2ークロロー4ー(トリフルオロメチル)フェニル基、4ーイソプロピルー2-(トリフルオロメチル)フェニル基、2ーニトロー4-(トリフルオロメチル)フェニル基、4ーブロモー3-(トリフルオロメチル)フェニル基、4ーブロモー3-(トリフルオロメチル)フェニル基、4ーブロモー2-(トリフルオロメチル)フェニル基、2ーブロモー4-(トリフルオロメチル)フェニル基、4ーフルオロー2-(トリフルオロメチル)フェニル基、4ーイソプロポキシー2-(トリフルオロメチル)フェニル基、4ーシアノー2-(トリフルオロメチル)フェニル基、4ーシアノー2ー(トリフルオロメチル)フェニル基、2、4ービス(トリフルオロメチル)フェニル基、2、4ービス(トリフルオロメチル)フェニル基

以下、上記一般式(I-2)で表される化合物について具体的に説明する。

Z<sup>2</sup>の定義における「5位に置換基を有していてもよい2-ヒドロキシフェニル基」、及び「5位に置換基を有していてもよい2-アセトキシフェニル基」の「置換基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。

上記 Z<sup>2</sup>の定義における「5位に置換基を有していてもよい2-ヒドロキシフェニル基」としては、好適には、「5位に置換基を有する2-ヒドロキシフェニル基」である。

上記 Z<sup>2</sup>の定義における「5位に置換基を有していてもよい2ーヒドロキシフェニル基」及び「5位に置換基を有する2ーヒドロキシフェニル基」の「置換基」としては、好適には、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、及びメトキシ基であり、最も好適には、ハロゲン原子である。

上記 Z<sup>2</sup>の定義における「5位に置換基を有していてもよい2ーアセトキシキシフェニル基」としては、好適には、「5位に置換基を有する2ーアセトキシフェニ

ル基」である。

上記 Z<sup>2</sup>の定義における「5位に置換基を有していてもよい2-アセトキシフェニル基」及び「5位に置換基を有する2-アセトキシフェニル基」の「置換基」としては、好適には、ハロゲン原子である。

E<sup>2</sup>の定義における「2,5-ジ置換フェニル基(該置換基のうち1個はトリフルオロメチル基である)」及び「3,5-ジ置換フェニル基(該置換基のうち1個はトリフルオロメチル基である)」の「置換基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。

 $E^2$ の定義における「2,5-ジ置換フェニル基(該置換基のうち1個はトリフルオロメチル基である)」としては、好適には、下記「置換基群  $\delta^2$ -1 e」から選択される基である。

[置換基群  $\delta^2 - 1$  e]  $2 - \rho \rho \rho \rho - \delta - \delta \rho \rho$  (トリフルオロメチル)フェニル基、 2, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基、2-フルオロ-5-(トリフ ルオロメチル)フェニル基、2-ニトロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル 基、2-メチル-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-メトキシ-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-メチルスルファニル-5-(トリフル オロメチル)フェニル基、2-(1-ピロリジニル)-5-(トリフルオロメチ ル)フェニル基、2-モルホリノ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2 ーブロモー5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-(2-ナフチルオキシ) -5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-(2,4-ジクロロフェノキシ) -5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-[4-(トリフルオロメチル) 2, 2-トリフルオロエトキシ) -5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2 - (2-メトキシフェノキシ)-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-(4-クロロー3,5-ジメチルフェノキシ)-5-(トリフルオロメチル)フ エニル基、2-ピペリジノー5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-(4 ーメチルフェノキシ) -5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-(4-ク

ロロフェノキシ)-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-(4-シアノフェノキシ)-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-(4-メトキシフェノキシ)-5-(トリフルオロメチル)フェニル基

 $E^2$ の定義における「3,5 - ジ置換フェニル基(該置換基のうち1個はトリフルオロメチル基である)」としては、好適には、下記「置換基群  $\delta^2$  - 2 e」から選択される基である。

「置換基群  $\delta^2 - 2$  e 」 3,  $5 - \forall x$  (トリフルオロメチル)フェニル基、 $3 - \forall x$  フルオロ-5 - ( トリフルオロメチル)フェニル基、 $3 - \forall x$  フェニル基、 $3 - \forall x$  フェニル基、 $3 - \forall x$  トキシ-5 - ( トリフルオロメチル)フェニル基、 $3 - \forall x$  トキシカルボニル-5 - ( トリフルオロメチル)フェニル基、 $3 - \forall x$  カルボキシ-5 - ( トリフルオロメチル)フェニル基

以下、上記一般式(I-3)で表される化合物について具体的に説明する。

Z³の定義における「5位に置換基を有していてもよい2-ヒドロキシフェニル基」、及び「5位に置換基を有していてもよい2-アセトキシフェニル基」の「置換基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。

上記 $Z^3$ の定義における「5位に置換基を有していてもよい2-ヒドロキシフェニル基」としては、好適には、「5位に置換基を有する2-ヒドロキシフェニル基」である。

上記 Z³の定義における「5位に置換基を有していてもよい2-ヒドロキシフェニル基」及び「5位に置換基を有する2-ヒドロキシフェニル基」の「置換基」としては、好適には、ハロゲン原子、ニトロ基、メチル基、及びメトキシ基であり、最も好適には、ハロゲン原子である。

上記 Z <sup>3</sup>の定義における「5位に置換基を有していてもよい2-アセトキシキシフェニル基」としては、好適には、「5位に置換基を有する2-アセトキシフェニル基」である。

上記 Z 3 の定義における「5 位に置換基を有していてもよい 2 - アセトキシフェ

ニル基」及び「5位に置換基を有する2-アセトキシフェニル基」の「置換基」 としては、好適には、ハロゲン原子である。

 $R^{3 \circ 2}$ 及び $R^{3 \circ 3}$ の定義における「置換基を有していてもよい炭化水素基」、並びに $R^{3 \circ 5}$ の定義における「置換基を有していてもよい $C_2 \sim C_6$ の炭化水素基」の「置換基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。

 $R^{3 \circ 2}$ 及び $R^{3 \circ 3}$ の定義における「置換基を有していてもよい炭化水素基」、並びに $R^{3 \circ 5}$ の定義における「置換基を有していてもよい $C_2 \sim C_6$ の炭化水素基」の「炭化水素基」としては、上記定義における「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。

R<sup>3</sup>e<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>e<sup>3</sup>の定義における「置換基を有していてもよいヒドロキシ基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基を有していてもよいヒドロキシ基」と同様の基が挙げられる。

 $E^3$ としては、好適には、3, 5ービス [(1, 1ージメチル)エチル] フェニル基、5ー[(1, 1-ジメチル)エチル] フェニル基、5-[(1, 1-ジメチル)エチル] ー2-メトキシフェニル基、4-メトキシビフェニルー3-イル基、5-[(1, 1-ジメチル)プロピル] ー2-フェノキシフェニル基、4-メチルビフェニルー3-イル基、及び5-[(1, 1-ジメチル)プロピル] ー2-ヒドロキシフェニル基であり、更に好適には、3, 5-ビス [(1, 1-ジメチル)エチル] フェニル基である。

以下、上記一般式(I-4)で表される化合物について具体的に説明する。

Z⁴の定義における「5位に置換基を有していてもよい2-ヒドロキシフェニル基」、及び「5位に置換基を有していてもよい2-アセトキシフェニル基」の「置換基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。

上記 Z 4 の定義における「5 位に置換基を有していてもよい 2 ーヒドロキシフェニル基」としては、好適には、「5 位に置換基を有する 2 ーヒドロキシフェニル基」

である。

上記 Z 4 の定義における「5 位に置換基を有していてもよい 2 ーヒドロキシフェニル基」及び「5 位に置換基を有する 2 ーヒドロキシフェニル基」の「置換基」としては、好適には、ハロゲン原子、フェニル基、4 ーフルオロフェニル基、2,4 ージフルオロフェニル基、4 ー (トリフルオロメチル)フェニル基、1 ーピロリル基、及び 2 ーチエニル基であり、最も好適には、ハロゲン原子である。

上記 Z <sup>4</sup>の定義における「5位に置換基を有していてもよい2ーアセトキシキシフェニル基」としては、好適には、「5位に置換基を有する2ーアセトキシフェニル基」である。

上記 Z⁴の定義における「5位に置換基を有していてもよい2-アセトキシフェニル基」及び「5位に置換基を有する2-アセトキシフェニル基」の「置換基」としては、好適には、ハロゲン原子である。

R<sup>4°4</sup>の定義における「置換基を有していてもよい炭化水素基」、並びにR<sup>4°5</sup>の 定義における「置換基を有していてもよいアシル基」及び「置換基を有していて もよいヘテロ環基」の「置換基」としては、上記「置換基を有していてもよい」 の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。

R<sup>4</sup>°<sup>4</sup>の定義における「置換基を有していてもよい炭化水素基」の「炭化水素基」としては、上記定義における「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。

R<sup>4 e 5</sup>の定義における「置換基を有していてもよいアシル基」の「アシル基」としては、上記定義における「アシル基」と同様の基が挙げられる。

R<sup>4°5</sup>の定義における「置換基を有していてもよいヘテロ環基」の「ヘテロ環基」としては、上記定義における「ヘテロ環基」と同様の基が挙げられる。

 $E^4$ としては、好適には、下記「置換基群  $\delta^4-1$  e」から選択される基であり、最も好適には、4-[(1, 1-ジメチル) エチル] -5-[(2, 2-ジメチル) プロピオニル] チアゾール-2-イル基である。

[置換基群  $\delta^4 - 1$  e ]  $5 - \vec{j}$  ロモー $4 - [(1, 1 - \vec{j}) \times \vec{j} \times \vec{j}]$  エチル] チアゾールー  $2 - \vec{j}$  ルルー  $2 - \vec{j}$  ルルー  $2 - \vec{j}$  リフルオロメチル) チアゾールー  $2 - \vec{j}$ 

イル基、5-シアノ-4-[(1,1-ジメチル) エチル] チアゾール-2-イル 基、5-メチルチアゾール-2-イル基、4-[(1,1-ジメチル)エチル]-5-[(2,2-ジメチル) プロピオニル] チアゾールー2-イル基、<math>4-[(1,2)]1-ジメチル) エチル] -5-(エトキシカルボニル) チアゾール-2-イル基、 4-[(1, 1-ジメチル) エチル] -5-ピペリジノチアゾール-2-イル基。4-[(1, 1-ジメチル) エチル] -5-モルホリノチアゾール-2-イル基、4-[(1, 1-ジメチル) エチル] -5-(4-メチルピペラジン-1-イル)チアゾール-2 ーイル基、4-[(1,1-ジメチル) エチル] -5-(4-フェニルピペラジン-1-イル)チアゾール-2-イル基、5-カルボキシメチル-4-フェニルチアゾール-2-イル基、5-アセチル-4-フェニルチアゾール -2-イル基、5-ベンゾイル-4-フェニルチアゾール-2-イル基、5-エ トキシカルボニルー4ーフェニルチアゾールー2ーイル基、5ーエトキシカルボ ニルー4-(ペンタフルオロフェニル)チアゾール-2-イル基、5-メチルカ ルバモイルー4-フェニルチアゾール-2-イル基、5-エチルカルバモイル-4-フェニルチアゾール-2-イル基、5-イソプロピルカルバモイル-4-フ ェニルチアゾール-2-イル基、5-(2-フェニルエチル)カルバモイル-4 -フェニルチアゾール-2-イル基、5-エトキシカルボニル-4-(トリフル オロメチル) チアゾールー2ーイル基、5ーカルボキシー4ー[(1,1ージメチ ル) エチル] チアゾールー2-イル基、5-カルボキシー4-フェニルチアゾー ルー2-イル基、5-プロピルカルバモイル-4-フェニルチアゾール-2-イ ル基

上記一般式 (I)、(I-1)、(I-2)、(I-3)、及び (I-4) で表される化合物としては、好適には、「下記一般式 (X-1) で表される置換安息香酸誘導体、及び/又は下記化合物群  $\phi-1$  で表される化合物」以外の化合物である。

$$R^{1001}$$
  $I$   $X^{1001}$   $(X-1)$ 

(式中、

 $R^{1001}$ は、下記の一般式 (X-2):

$$R^{1003}$$
 $R^{1005}$ 
 $R^{1004}$ 
 $CH_2$ 
 $(X-2)$ 

または、下記の一般式 (X-3):

$$R^{1003}$$
 $R^{1004}$ 
 $CH_2$ 
 $(X-3)$ 

(式中、 $R^{1003}$ 、 $R^{1004}$ および $R^{1005}$ は各々独立に水素原子、炭素数 $1\sim6$ のアルキル基または炭素数 $1\sim6$ のアルコキシ基であり、 $R^{1009}$ および $R^{1010}$ は各々独立に水素原子、炭素数 $1\sim6$ のアルキル基または炭素数 $2\sim1$ 1のアシル基を示す)であり;

 $R^{1002}$ は、水素原子、置換されていてもよい炭素数  $1\sim6$  の低級アルキル基、置換されていてもよい炭素数  $6\sim1$  2 のアリール基、置換されていてもよい炭素数  $4\sim1$  1 のヘテロアリール基、置換されていてもよい炭素数  $7\sim1$  4 のアラルキル基、置換されていてもよい炭素数  $5\sim1$  3 のヘテロアリールアルキル基を示すか、あるいは炭素数  $2\sim1$  1 のアシル基であり;

 $X^{1001}$ は、エステル化またはアミド化されていてもよいカルボキシル基を示す。) [化合物群 $\phi-1$ ]

OHCHN OH O N 
$$CF_3$$
  $O_2N$   $O_1N$   $O_2N$   $O_2N$   $O_3N$   $O_4N$   $O$ 

上記一般式 (I-1)、(I-2)、(I-3)、及び (I-4) で定義される化合物 若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶 媒和物はいずれも新規化合物であり、本物質発明に基づく化合物の用途に関して は特に限定されない。

上記一般式(I)、(I-1)、(I-2)、(I-3)、及び(I-4)で表される化合物は塩を形成することができる。薬理学的に許容される塩としては、酸性基が存在する場合には、例えば、リチウム塩、ナトリウム塩、カリウム塩、マグネシウム塩、カルシウム塩等の金属塩、又はアンモニウム塩、メチルアンモニウム塩、ジメチルアンモニウム塩、トリメチルアンモニウム塩、ジシクロヘキシルアンモニウム塩等のアンモニウム塩をあげることができ、塩基性基が存在する場合には、例えば、塩酸塩、臭酸塩、硫酸塩、硝酸塩、リン酸塩等の鉱酸塩、あるいはメタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、パラトルエンスルホン酸塩、酢酸塩、プロピオン酸塩、酒石酸塩、フマール酸塩、マレイン酸塩、リンゴ酸塩、シュウ酸塩、コハク酸塩、クエン酸塩、安息香酸塩、マンデル酸塩、ケイ皮酸塩、乳酸塩等の有機酸塩をあげることができる。グリシンなどのアミノ酸と塩を形成する場合もある。本発明の医薬の有効成分としては、薬学的に許容される塩も好適に用いることができる。

上記一般式 (I)、(I-1)、(I-2)、(I-3)、及び (I-4) で表される化合物又はその塩は、水和物又は溶媒和物として存在する場合もある。本発明の医

薬の有効成分としては、上記のいずれの物質を用いてもよい。さらに一般式(I)、 (I-1)、(I-2)、(I-3)、及び(I-4)で表される化合物は1以上の不 
斉炭素を有する場合があり、光学活性体やジアステレオマーなどの立体異性体と 
して存在する場合がある。本発明の医薬の有効成分としては、純粋な形態の立体 
異性体、光学対掌体又はジアステレオマーの任意の混合物、ラセミ体などを用い 
てもよい。

また、一般式(I)、(I-1)、(I-2)、(I-3)、及び(I-4)で表される 化合物が例えば2-ヒドロキシピリジン構造を有する場合、その互変異性体(t automer)である2-ピリドン構造として存在する場合がある。本発明の 医薬の有効成分としては、純粋な形態の互変異性体又はそれらの混合物を用いて もよい。また、一般式(I)、(I-1)、(I-2)、(I-3)、及び(I-4)で表される化合物がオレフィン性の二重結合を有する場合には、その配置はZ配置 又はE配置のいずれでもよく、本発明の医薬の有効成分としてはいずれかの配置 の幾何異性体又はそれらの混合物を用いてもよい。

本発明の医薬の有効成分として一般式(I)に包含される化合物を以下に例示するが、本発明の医薬の有効成分は下記の化合物に限定されることはない。

なお、下記表において用いられる略語の意味は下記の通りである。

Me:メチル基、Et:エチル基。

化合物番号	A . 0 z	X	E
1	OH Br	O N H	CF <sub>3</sub>
2	OH Br	O H	
3	OH Br	O N H	O N O
4	OH MeO OH	•	OMe
5	OH CI	OH OH	CI
6	OH MeO	•	MeO

7	OH Me		, o
8	Me O O		
9	OH		CI
1 0	OH Br	0 0 S N H	CI
1 1	OH OH	H N O	CF <sub>3</sub>
1 2	OH	H	CI
1 3	OH	H N S O O	CI
1 4	OH Br	∕^N H	CI
1 5	OH Br	O N N	ОН

1 6	OH	O N Me	CF <sub>3</sub>
1 7	OH Br	O	CF <sub>3</sub>

化合物番号	A o	E
1 8	ОН	2
1 9	ОН	CI
2 0	ОН	OMe OMe
2 1	OH	CF <sub>3</sub>
2 2	OH	SO <sub>2</sub> F

2 3	OH Z C	SO₂F
2 4	OH N CI	CF <sub>3</sub>
2 5	OH N CI	CF <sub>3</sub>
2 6	OH N CI	Me Me Me Me
2 7	OH N	CF <sub>3</sub>
2 8	OH HN CI	CF <sub>3</sub>
2 9	OH N	CF <sub>3</sub>

3 0	OH	CI
	HN	,

化合物番号	A O	E
3 1	ОН	
3 2	OH	
3 3	OH	OMe
3 4	O Me CI	OMe

化合物番号	A O	E
3 5	OH	EtO <sub>2</sub> C
3 6	OH Br	N-NH
3 7	OH Br	N Et
3 8	OH Br	N N
3 9	OH Br	N O
4 0	ОН	N-N CF <sub>3</sub>

4 1	OH Br	N-N CF <sub>3</sub>
4 2	OH CI	CI
4 3	OH	OMe N CI
4 4	Me O CI	H
4 5	Me O	HN CO <sub>2</sub> Et
4 6	OH CI	, N
4 7	OH	Et N

化合物番号	. A O	E
4 8	OH	CF <sub>3</sub>
4 9	OH F	CF <sub>3</sub>
5 0	OH.	CF <sub>3</sub>
5 1	OH Br	CF <sub>3</sub>
5 2	ОН	CF <sub>3</sub>
5 3	OH NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>

5 4	OH CN	CF <sub>3</sub>
5 5	OH Me	CF <sub>3</sub>
5 6	OH Me Me	CF <sub>3</sub>
5 7	НО	CF <sub>3</sub>
5 8	MeO N Me	CF <sub>3</sub>
5 9	OH O N Me	CF <sub>3</sub>
6 0	OH CN	CF <sub>3</sub>

6 1	OH CN CO₂H	CF <sub>3</sub>
6 2	OH CN CO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>
6 3	OH	CF <sub>3</sub>
6 4	OH H	CF <sub>3</sub>
6 5	OH OH	CF <sub>3</sub>

6 6	OH SiMe <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
6 7	OH	CF <sub>3</sub>
6 8	OH	CF <sub>3</sub>
6 9	OH CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
7 0	OH CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
7 1	OH N	CF <sub>3</sub>

7 2	OH S	CF <sub>3</sub>
7 3	OH S	CF <sub>3</sub>
7 4	OH N S— Me	CF <sub>3</sub>
7 5	OH N N N	CF <sub>3</sub>
7 6	OH N	CF <sub>3</sub>
7 7	OH OMe	CF <sub>3</sub>

7 8	OH O Me	CF <sub>3</sub> CF <sub>3</sub>
7 9	OH Me Me	CF <sub>3</sub>
8 0	OH CO₂H	CF <sub>3</sub>
8 1	OH CO <sub>2</sub> Me	CF <sub>3</sub>
8 2	OH CF <sub>3</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
8 3	OH ONMe <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
8 4	O N	CF <sub>3</sub>

8 5	OH OH	CF <sub>3</sub>
8 6	OH O=S=O NMe <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
8 7	OH O=S=O N	CF <sub>3</sub>
8 8	OH NH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
8 9	OH NMe <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
9 0	OH HN O	CF <sub>3</sub>
9 1	OH H HN N O	CF <sub>3</sub>

9 2	OH H HN S	CF <sub>3</sub>
9 3	OH N N NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
9 4	OH N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	CF <sub>3</sub>
9 5	Me	CF <sub>3</sub>
9 6	Me O CI	CF <sub>3</sub>

9 7	OH ON H CI	CF <sub>3</sub>
9 8	CI	CF <sub>3</sub>
9 9	OH	CF <sub>3</sub> CF <sub>3</sub>
100	2 F	CF <sub>3</sub>
101	OH Br	CF <sub>3</sub>
102	OH Me	CF <sub>3</sub>
103	O	CF <sub>3</sub> CF <sub>3</sub>

化合物番号	A O	E
104	OH	F <sub>3</sub> C
1 0 5	OH	F <sub>3</sub> C CI
106	OH Br	CF <sub>3</sub>
1 0 7	OH	CF <sub>3</sub>
108	OH	CF <sub>3</sub> F
1 0 9	OH Br	CF <sub>3</sub>

110	OH CI	CF <sub>3</sub>
111	OH Br	CF <sub>3</sub>
112	OH	CF <sub>3</sub>
113	OH	CF <sub>3</sub>
114	OH Br	CF <sub>3</sub>
1 1 5	OH	CF <sub>3</sub> NO <sub>2</sub>
1 1 6	OH CI	CF <sub>3</sub>
117	OH Br	CF <sub>3</sub> CN
1 1 8	OH CI	CF <sub>3</sub>

1 1 9	OH	CF <sub>3</sub>
	CI	
1 2 0	OH	CF <sub>3</sub>
	CI	Me
1 2 1	OH	CF <sub>3</sub>
1 2 2	OH Br	CF <sub>3</sub>
1 2 3	OH Br	CF <sub>3</sub>
1 2 4	OH CI	CF <sub>3</sub>
1 2 5	OH	CF <sub>3</sub>
1 2 6	OH Br	CF <sub>3</sub>

1 2 7	OH Br	CF <sub>3</sub>
1 2 8	OH	CF <sub>3</sub>
1 2 9	OH Br	CI CF <sub>3</sub>
1 3 0	0 0 0	CF <sub>3</sub>
1 3 1	OH NO <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
1 3 2	OH Me	CF <sub>3</sub>
1 3 3	OH OMe	CF <sub>3</sub>
1 3 4	OH Me	CF <sub>3</sub>

	T	
1 3 5	OH Me	CF <sub>3</sub> Me
136	OH Me	CF <sub>3</sub>
137	OH Me	CF <sub>3</sub>
1 3 8	OH Me	CF <sub>3</sub>

化合物番号	A O	E
1 3 9	OH Br	
1 4 0	OH Br	CI
1 4 1	OH Br	CI
1 4 2	OH CI	CI
1 4 3	OH Br	CI
144	OH Br	F

1 4 5	ОН	C C
1 4 6	OH F	CI
1 4 7	OH	CI
1 4 8	OH Br	C C
1 4 9	OH	CI
150	OH Br Br	CI
1 5 1	OH	CI
1 5 2	OH NO <sub>2</sub>	CI
153	OH Me	CI

1 5 4	OH OMe	CI
1 5 5	OH Br	CI
156	OH Br	CI
157	OH	F F F
1 5 8	OH Br	NO <sub>2</sub>
159	OH	Me Me Me Me
160	OH	Me Me Me OMe
161	OH Br	Me Me

162	OH CI	Me Me Me Me Me
163	OH Br	Me Me Me Me
164	OH	Me Me Me Me
165	OH	
166	OH	OMe
167	OH Br	OMe OMe
168	OH Br	OMe

169	OH	Me
170	OH Br	CO <sub>2</sub> Me
171	ОН	H H N S CI CI
172		CI
173	OH Me	Me Me Me Me
174	0-0-0-0	Me Me Me Me Me
175	OH NO <sub>2</sub>	Me Me Me Me Me

176	OH Me	Me Me Me Me
177	OH OMe	Me Me Me Me
178	0 0 0	Me Me Me OMe
1 7 9	OH Me	Me Me Me OMe

化合物番号	A o	E
	QH QH	
180	Br	→ N J
181	OH Br	Me Me Me S Br
182	OH Br	N CF <sub>3</sub>
183	OH	Me Me S CN
184	OH Br	Me Me Me S CN
185	OH Br	→ N N Me

1 8 6	OH Br	Me Me Me
187	OH Br	N Me S Me
188	OH Br	N Me
189	OH Br	N Me S F
190	OH Br	N Me CF <sub>3</sub>
191	OH Br	Me Me Me S Et
192	OH Br	N Et
193	OH Br	Me S Me

194	OH Br	N Me
195	OH	Me Me Me S O Me Me Me
196	OH Br	Me Me Me S O Me Me Me
197	OH Br	N Me Me Me CO <sub>2</sub> Et
198	OH Br	Me Me Me S N
199	OH Br	Me Me Me S N O
200	OH Br	Me Me Me S N N N Me

Ō

2 0 1	OH Br	Me Me Me Me
202	OH Br	» »
203	OH Br	N CO <sub>2</sub> H
204	OH Br	N S
2 0 5	OH Br	N S
206	OH Br	N CF <sub>3</sub>
207	OH Br	N Me

2 0 8	OH Br	N O O
2 0 9	OH Br	N CO <sub>2</sub> Et
2 1 0	OH OH	N S CO <sub>2</sub> Et
2 1 1	OH Br	N F F CO <sub>2</sub> Et
2 1 2	OH Br	N H N Me
2 1 3	OH Br	S N Et
2 1 4	OH Br	N H Me O Me

	1	
2 1 5	OH Br	N H N
2 1 6	OH Br	S CO <sub>2</sub> Et
2 1 7	0	N Me Me Me S O Me Me Me
2 1 8	OH \	N S CO <sub>2</sub> Et
2 1 9	OH F	N S CO <sub>2</sub> Et
2 2 0	OH F	S CO <sub>2</sub> Et

2 2 1	OH CF <sub>3</sub>	N S CO <sub>2</sub> Et
2 2 2	OH N	N S CO <sub>2</sub> Et
223	OH S	S CO <sub>2</sub> Et

化合物番号	A O	X	E
3 0 1	OH CI		
3 0 2	OH	O H N H N N N N N N N N N N N N N N N N	CF <sub>3</sub>
3 0 3	OH	O H N H N	CF <sub>3</sub>
3 0 4	OH	O N N	CF <sub>3</sub>
3 0 5	OH	Me Me H N	CF <sub>3</sub>
306	OH CI	N,N O	CF <sub>3</sub>

3 0 7	OH CI	O N H	CF <sub>3</sub>
3 0 8	OH	0 N— 0	CF <sub>3</sub>
3 0 9	OH	O N H H	CF <sub>3</sub>
3 1 0	OH C		CF <sub>3</sub>
3 1 1	OH CI	O N H	
3 1 2	OH	N H	CF <sub>3</sub>
3 1 3	OH CI	O Me	CF <sub>3</sub>
3 1 4	OH CI	O H N O O O O O O O O O O O O O O O O O	CF <sub>3</sub>
3 1 5	OH CI	O H	CF <sub>3</sub>

3 1 6	OH CI		CF <sub>3</sub>
3 1 7	OH C	O NH HX HX	CF <sub>3</sub>
3 1 8	OH	S NH O	CF <sub>3</sub>
3 1 9	OH	O N O	CF <sub>3</sub>
3 2 0	OH O N		CF <sub>3</sub>
3 2 1	OH	N, N	CF <sub>3</sub>

化合物番号	A O	E
3 2 2	ОН	CF <sub>3</sub>
3 2 3	Me Me	CF <sub>3</sub>
3 2 4	OH HO Br	CF <sub>3</sub>
3 2 5	НО	CF <sub>3</sub>
3 2 6	CI	CF <sub>3</sub>
3 2 7	HO	CF <sub>3</sub>

3 2 8	OH Me	CF <sub>3</sub>
3 2 9	OH MeO	CF <sub>3</sub>
3 3 0	OH Me Me Me Me	CF <sub>3</sub>
3 3 1	CI CI	CF <sub>3</sub>
3 3 2	Me OH Me Me Me Me	CF <sub>3</sub>
3 3 3	OH F	CF <sub>3</sub>
3 3 4	CI	CF <sub>3</sub>
3 3 5	MeO	CF <sub>3</sub>

3 3 6	OH OMe	CF <sub>3</sub>
3 3 7	OH NHSO₂Me	CF <sub>3</sub>
3 3 8	OH ON SON	CF <sub>3</sub>
3 3 9	OH HN Me	CF <sub>3</sub>
3 4 0	OH SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
3 4 1	OH	CF <sub>3</sub>
3 4 2	OH	CF <sub>3</sub>
3 4 3	OH Br S	CF <sub>3</sub>

3 4 4	OH HN	CF <sub>3</sub>
3 4 5	OH HN CI	CF <sub>3</sub>
3 4 6	OH	CF <sub>3</sub>
3 4 7	OH C	CF <sub>3</sub>
3 4 8	OH G	CF <sub>3</sub>
3 4 9	OH	CF <sub>3</sub>
3 5 0	OH	CF <sub>3</sub> CO <sub>2</sub> Me
3 5 1	CI	CF <sub>3</sub>